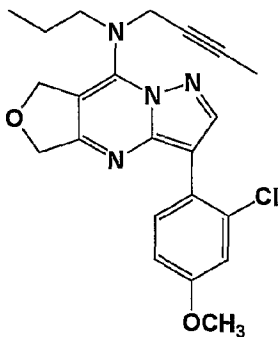


TLC : R<sub>f</sub> 0.56 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  8.42 (s, 1H), 7.75 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.19 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.13 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.06 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.93 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.24 (s, 2H), 4.95 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.42 (d, J = 6.3Hz, 2H), 2.33 (s, 3H), 1.04 (m, 1H), 0.58 - 0.46 (m, 2H), 0.18 - 0.04 (m, 2H)。

### 実施例 2 (332)

8 - (N-プロピル-N-(2-ブチニル) アミノ) - 3 - (2-クロロ  
10 4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ[3, 4-d]ピラゾロ  
[1, 5-a]ピリミジン



TLC : Rf 0.41 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

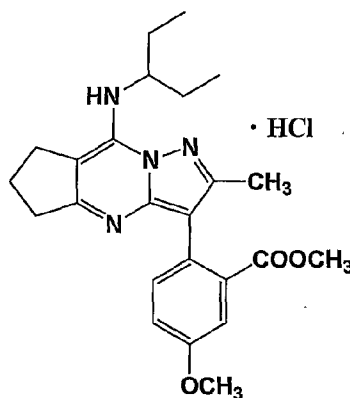
NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  8.37 (s, 1H), 7.71 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.05 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.92 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 5.34 (s, 2H), 4.97 (s, 2H), 4.44 (q, J = 2.4Hz, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.52 (m, 2H), 1.82 (t, J = 2.4Hz, 3H), 1.80 - 1.62 (m, 2H),

5 0.98 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

### 実施例 2 (333)

8 - (3 - ペンチルアミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - メトキシカルボニル - 4 - メトキシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ [d]

10 ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



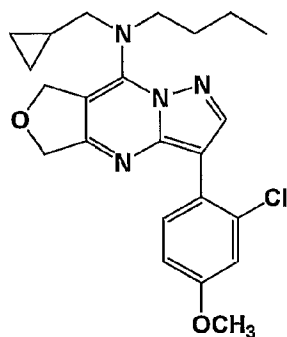
TLC : Rf 0.26 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  7.70 (d, J = 2.7Hz, 1H), 7.34 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.30 - 7.16 (m) and 7.19 (dd, J = 8.4, 2.7Hz) total 2H, 4.03 - 3.83 (m) and 3.89 (s) total 4H, 3.77 (s, 3H), 3.54 - 3.36 (m, 2H), 3.11 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.33 - 2.00 (m) and 2.25 (s) total 4H, 1.90 - 1.58 (m, 4H), 1.05 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

### 実施例 2 (334)

8 - (N - ブチル - N - シクロプロピルメチルアミノ) - 3 - (2 - クロロ

－4－メトキシフェニル)－5，7－ジヒドロフロ[3，4－d]ピラゾ  
ロ[1，5－a]ピリミジン

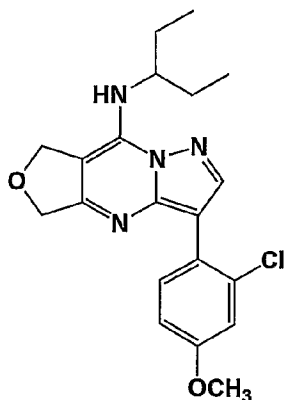


TLC : R<sub>f</sub> 0.45 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

- 5 NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  8.37 (s, 1H), 7.74 (d, J = 9.0Hz, 1H), 7.05 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 9.0, 2.7Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 4.96 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.66 - 3.52 (m, 4H), 1.66 - 1.48 (m, 2H), 1.44 - 1.22 (m, 2H), 1.04 (m, 1H), 0.91 (t, J = 7.2Hz, 3H), 0.60 - 0.44 (m, 2H), 0.22 - 0.08 (m, 2H)。

#### 10 実施例 2 (335)

8－(3－ペンチルアミノ)－3－(2－クロロ－4－メトキシフェニル)  
－5，7－ジヒドロフロ[3，4－d]ピラゾロ[1，5－a]ピリミジ  
ン



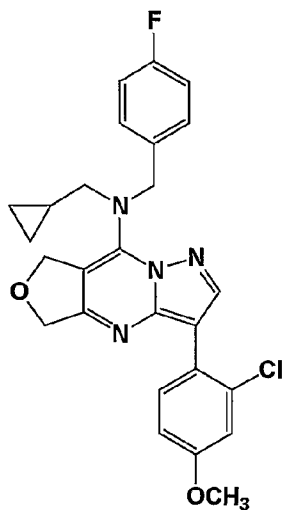
TLC : Rf 0.57 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  8.32 (s, 1H), 7.74 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.04 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 6.42 (d, J = 10.8Hz, 1H), 5.31 (s, 2H), 4.97 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.28 (m, 1H), 1.84 - 1.54 (m, 4H), 1.01 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

5

### 実施例 2 (336)

8 - (N-シクロプロピルメチル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ) - 3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ[3, 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン



10

TLC : Rf 0.41 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

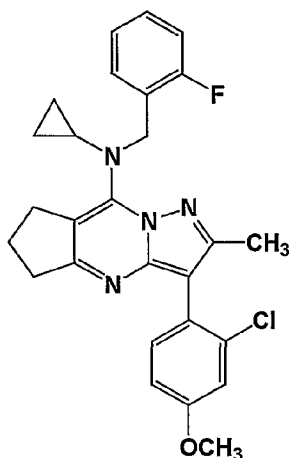
NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  8.41 (s, 1H), 7.74 (d, J = 9.0Hz, 1H), 7.38 - 7.24 (m, 2H), 7.12 - 6.96 (m, 3H), 6.92 (dd, J = 9.0, 2.7Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 4.95 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.39 (d, J = 6.9Hz, 2H), 1.02 (m, 1H), 0.60 - 0.44 (m, 2H),

15 0.16 - 0.02 (m, 2H)。

### 実施例 2 (337)

8 - (N-シクロプロピル-N-(2-フルオロフェニル)メチルアミノ)

－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ[d]ピラゾロ[1，5－a]ピリミジン

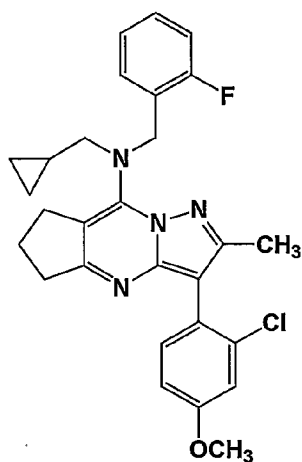


TLC : R<sub>f</sub> 0.41 (トルエン : 酢酸エチル = 10 : 1) ;

- 5 NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.23 (m, 1H), 7.13 - 6.97 (m, 3H), 7.06 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.15 (brs, 2H), 3.84 (s, 3H), 2.98 - 2.86 (m, 4H), 2.83 (m, 1H), 2.40 (s, 3H), 2.02 (m, 2H), 0.84 - 0.72 (m, 4H)。

#### 10 実施例2 (338)

8－（N－シクロプロピルメチル－N－（2－フルオロフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ[d]ピラゾロ[1，5－a]ピリミジン

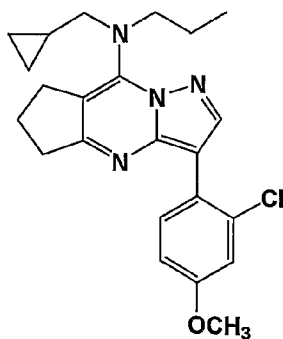


TLC : R<sub>f</sub> 0.49 (トルエン : 酢酸エチル = 10 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 7.32 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.35 - 7.16 (m, 2H), 7.06 (d, J = 2.4Hz, 1H), 7.08 - 6.97 (m, 2H), 6.89 (dd, J = 8.7Hz, 2.4Hz, 1H), 5.02 (s, 2H), 3.84  
 5 (s, 3H), 3.41 (d, J = 6.9Hz, 2H), 2.98 - 2.84 (m, 4H), 2.40 (s, 3H), 2.07 (m, 2H), 1.05  
 (m, 1H), 0.48 (m, 2H), 0.10 (m, 2H)。

### 実施例 2 (339)

8 - (N-シクロプロピルメチル-N-プロピルアミノ) - 3 - (2-クロ  
 10 ロ - 4 - メトキシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ [d]  
 ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン



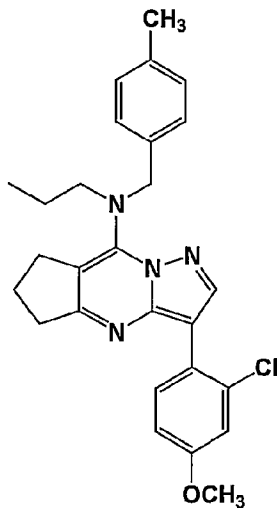
TLC : R<sub>f</sub> 0.76 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  8.32 (s, 1H), 7.78 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.03 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.68 - 3.58 (m, 2H), 3.52 (d, J = 6.9Hz, 2H), 3.06 - 2.90 (m, 4H), 2.26 - 2.08 (m, 2H), 1.66 - 1.46 (m, 2H), 1.01 (m, 1H), 0.90 (t, J = 7.2Hz, 3H), 0.52 - 0.42 (m, 2H), 0.16 - 0.04 (m, 2H)。

5

### 実施例 2 (340)

8 - (N-プロピル-N-(4-メチルフェニル)メチルアミノ) - 3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン



10

TLC : Rf 0.61 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

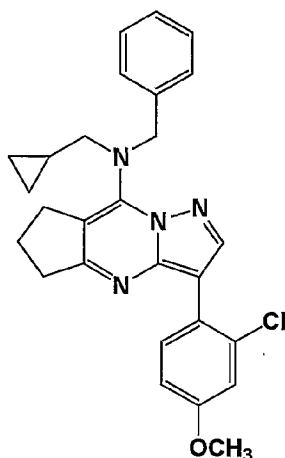
NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  8.37 (s, 1H), 7.79 (d, J = 9.0Hz, 1H), 7.18 - 7.07 (m, 4H), 7.04 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.92 (dd, J = 9.0, 2.7Hz, 1H), 4.79 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.45 - 3.36 (m, 2H), 2.96 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.89 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.20 - 2.04 (m, 2H), 1.66 - 1.46 (m, 2H), 0.87 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

15

### 実施例 2 (341)

8 - (N-ベンジル-N-シクロプロピルメチルアミノ) - 3 - (2-クロ

ロー 4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d]  
ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

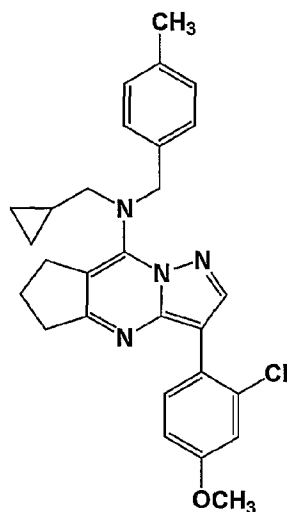


TLC : R<sub>f</sub> 0.67 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

- 5 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  8.38 (s, 1H), 7.79 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.38 - 7.18 (m, 5H), 7.05 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.92 (dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 4.92 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.40 (d, J = 6.9Hz, 2H), 3.01 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.97 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.22 - 2.06 (m, 2H), 1.02 (m, 1H), 0.54 - 0.42 (m, 2H), 0.12 - 0.02 (m, 2H)。

#### 10 実施例 2 (342)

8- (N-シクロプロピルメチル-N- (4-メチルフェニル) メチルアミノ) - 3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

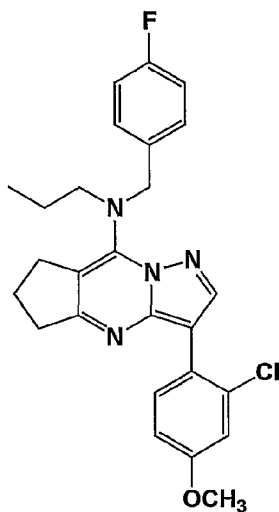


TLC : Rf 0.71 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 8.37 (s, 1H), 7.79 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.20 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.11 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.05 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.92 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.88 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.39 (d, J = 6.6Hz, 2H), 3.01 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.97 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.22 - 2.06 (m, 2H), 1.02 (m, 1H), 0.54 - 0.42 (m, 2H), 0.14 - 0.02 (m, 2H)。

### 実施例 2 (343)

- 10 8- (N-プロピル-N- (4-フルオロフェニル) メチルアミノ) -3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

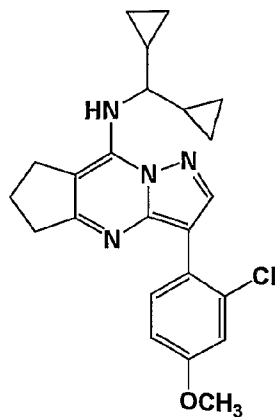


TLC: R<sub>f</sub> 0.54 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1);

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  8.37 (s, 1H), 7.79 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.30 - 7.22 (m, 2H), 7.05 (d, J = 2.4Hz, 1H), 7.04 - 6.96 (m, 2H), 6.92 (dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 4.78 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.46 - 3.34 (m, 2H), 2.97 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.89 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.20 - 2.04 (m, 2H), 1.66 - 1.48 (m, 2H), 0.87 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

### 实施例 2 (3 4 4)

8-ジシクロプロピルメチルアミノ-3-(2-クロロ-4-メトキシフェ  
10 ニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-  
a]ピリミジン

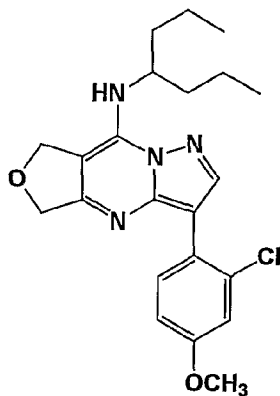


TLC : Rf 0.58 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  8.28 (s, 1H), 7.78 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.03 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 6.42 (d, J = 9.6Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.44 (m, 1H), 3.10 - 3.00 (m, 2H), 2.98 - 2.88 (m, 2H), 2.22 - 2.06 (m, 2H), 1.20 - 1.06 (m, 2H), 0.68 - 0.48 (m, 4H), 0.48 - 0.34 (m, 4H)。

#### 実施例 2 (345)

8 - (4-ヘプチルアミノ) - 3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ[3, 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン



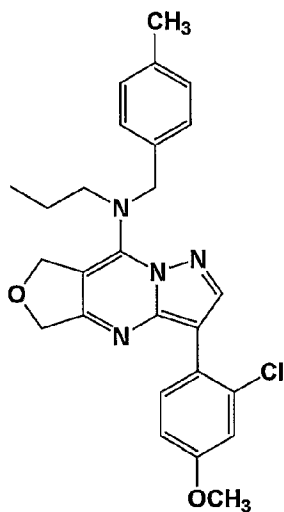
TLC : Rf 0.54 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  8.32 (s, 1H), 7.74 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.04 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.92 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 6.42 (d, J = 10.8Hz, 1H), 5.32 (s, 2H), 4.97 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.42 (m, 1H), 1.78 - 1.26 (m, 8H), 0.95 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

#### 実施例 2 (346)

8 - (N-プロピル-N-(4-メチルフェニル)メチルアミノ) - 3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ[3, 4-d]

ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

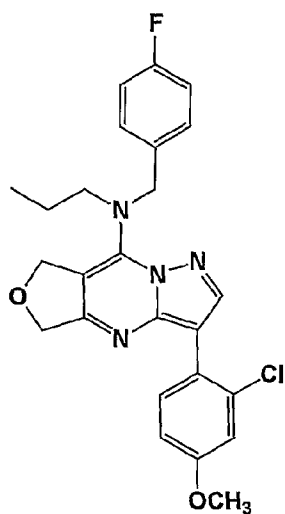


TLC : R<sub>f</sub> 0.53 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 8.41 (s, 1H), 7.75 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.16 - 7.08 (m, 4H), 7.06 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.92 (dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 5.14 (s, 2H), 4.95 (s, 2H), 4.88 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.42 - 3.28 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 1.72 - 1.50 (m, 2H), 0.89 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

#### 実施例 2 (347)

10 8 - (N-プロピル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ) - 3 -  
(2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ [3, 4  
- d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

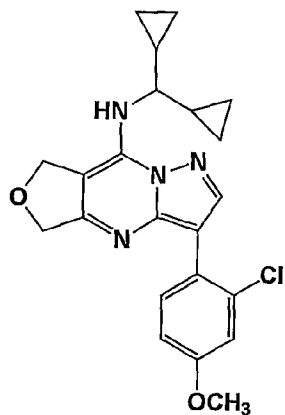


TLC : R<sub>f</sub> 0.50 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 8.41 (s, 1H), 7.74 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.32 - 7.18 (m, 2H), 7.08 - 6.97 (m, 3H), 6.93 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.15 (s, 2H), 4.95 (s, 2H),  
 5 4.88 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.40 - 3.26 (m, 2H), 1.70 - 1.48 (m, 2H), 0.89 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

### 実施例 2 (348)

8-ジシクロプロピルメチルアミノ-3-(2-クロロ-4-メトキシフェ  
 10 ニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピ  
 リミジン



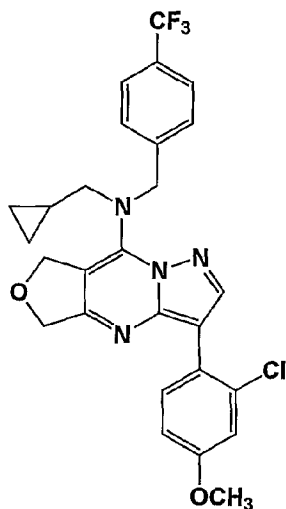
TLC : R f 0.47 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 8.33 (s, 1H), 7.73 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.04 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 6.55 (d, J = 9.6Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 4.94 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 2.92 (m, 1H), 1.22 - 1.06 (m, 2H), 0.70 - 0.48 (m, 4H), 0.48 -

5 0.30 (m, 4H)。

### 実施例 2 (349)

8 - (N-シクロプロピルメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)  
メチルアミノ) - 3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジ  
10 ヒドロフロ[3, 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン

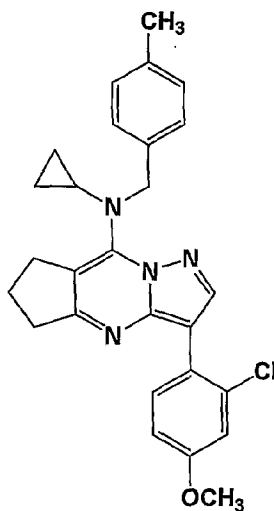


TLC : R f 0.42 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 8.41 (s, 1H), 7.73 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.60 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.50 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.06 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.93 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.27 (s, 2H), 5.02 (s, 2H), 4.96 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.40 (d, J = 6.6Hz, 2H),  
15 1.02 (m, 1H), 0.60 - 0.46 (m, 2H), 0.16 - 0.04 (m, 2H)。

### 実施例 2 (350)

8- (N-シクロプロピル-N- (4-メチルフェニル) メチルアミノ) -  
3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シ  
クロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

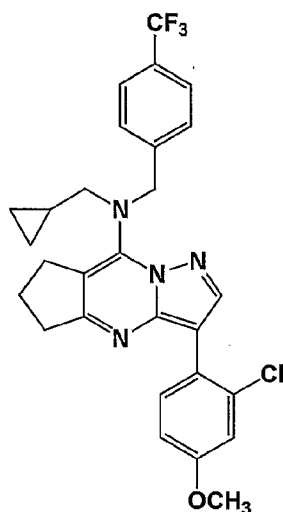


- 5 TLC : R<sub>f</sub> 0.60 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;  
NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  8.36 (s, 1H), 7.80 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.12 - 6.99 (m, 5H), 6.93 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.96 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 2.97 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.94 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.78 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 2.16 - 2.00 (m, 2H), 0.82 - 0.68 (m, 4H)。

10

#### 実施例 2 (351)

8- (N-シクロプロピルメチル-N- (4-トリフルオロメチルフェニル)  
メチルアミノ) -3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジ  
ヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

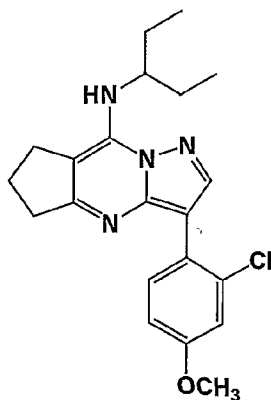


TLC : R<sub>f</sub> 0.55 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 8.37 (s, 1H), 7.78 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.58 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.49 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.05 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.92 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 4.97 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.39 (d, J = 6.6Hz, 2H), 3.04 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.99 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.18 (m, 2H), 1.01 (m, 1H), 0.56-0.42 (m, 2H), 0.14-0.02 (m, 2H)。

## 実施例 2 (352)

8 - (3 - ペンチルアミノ) - 3 - (2 - クロロ - 4 - メトキシフェニル)  
 10 - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピ  
 リミジン



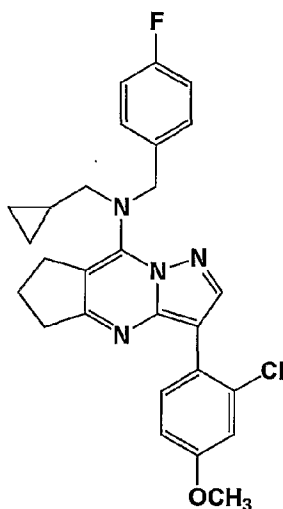
TLC : Rf 0.53 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 8.27 (s, 1H), 7.79 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.03 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 6.30 (d, J = 10.2Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.82 (m, 1H), 3.11 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.96 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.24-2.08 (m, 2H),

5 1.84-1.52 (m, 4H), 1.01 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

### 実施例 2 (353)

8 - (N-シクロプロピルメチル-N-(4-フルオロフェニル)メチルア  
ミノ) - 3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-  
10 5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン

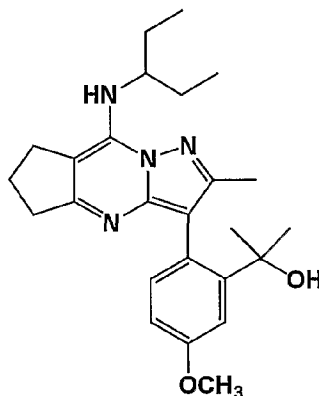


TLC : Rf 0.46 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 8.37 (s, 1H), 7.78 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.38-7.24 (m, 2H), 7.05 (d, J = 2.7Hz, 1H), 7.05-6.93 (m, 2H), 6.92 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 4.87  
15 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.37 (d, J = 6.9Hz, 2H), 3.01 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.97 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.22-2.06 (m, 2H), 1.00 (m, 1H), 0.54-0.40 (m, 2H), 0.12-0.02 (m, 2H)。

### 実施例 2 (354)

8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-(1-メチル-1-ヒドロキシエチル)-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



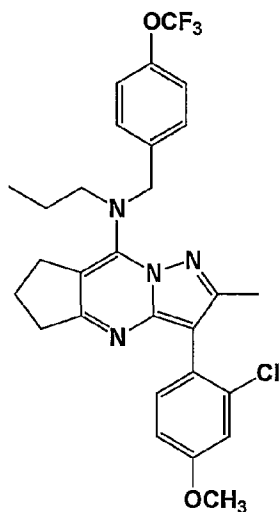
5 TLC : R f 0.50 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 2) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  7.23 (d, J = 2.7Hz, 1H), 7.03 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 6.26 (d, J = 10.2Hz, 1H), 5.00-4.85 (m, 1H), 3.85-3.75 (m) and 3.84 (s) total 4H, 3.06 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.85 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.29 (s, 3H), 2.11 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.80-1.50 (m) and 1.64 (s) total 7H, 1.30 (s, 3H), 1.03 (t,

10 J = 7.2Hz) and 1.00 (t, J = 7.2Hz) total 6H.

### 実施例 2 (355)

8-(N-プロピル-N-(4-トリフルオロメチルオキシフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

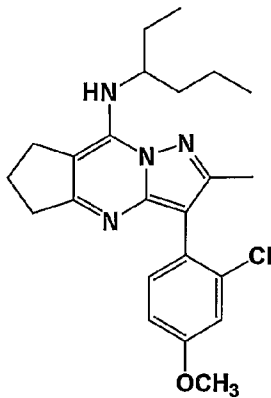


TLC : R<sub>f</sub> 0.52 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  7.32 (d, J = 9.0Hz, 2H), 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.15 (d, J = 9.0Hz, 2H), 7.07 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.84 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.44-3.32 (m, 2H), 2.91 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.84 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.06-1.98 (m, 2H), 1.66-1.48 (m, 2H), 0.88 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

#### 実施例 2 (356)

8 - (3-ヘキシルアミノ) - 2-メチル - 3 - (2-クロロ - 4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ - 5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

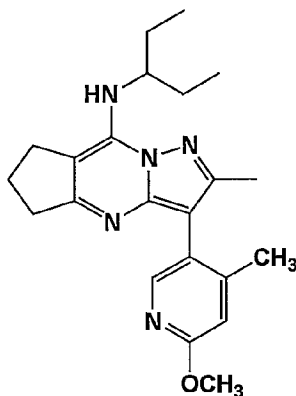


T L C : R f 0.44 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  7.30 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.05 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.88 (dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 6.22 (d, J = 10.8Hz, 1H), 3.84 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.08 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.90 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.20-2.04 (m, 2H), 1.80-1.32 (m, 5 6H), 1.00 (t, J = 6.9Hz, 3H), 0.95 (t, J = 6.9Hz, 3H)。

### 実施例 2 (357)

8 - (3 - ペンチルアミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - メトキシ - 4 - メチル  
 10 ラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン



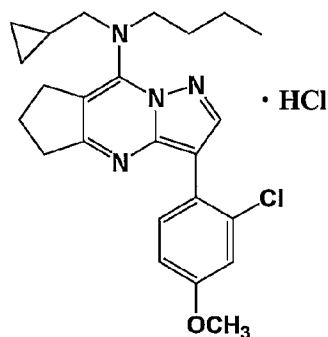
T L C : R f 0.23 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  8.00 (s, 1H), 6.69 (s, 1H), 6.23 (d, J = 10.5Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.82 (m, 1H), 3.08 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.89 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.32 (s, 15 3H), 2.20-2.06 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 1.82-1.54 (m, 4H), 1.02 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

### 実施例 2 (358)

8 - (N - ブチル - N - シクロプロピルメチルアミノ) - 3 - (2 - クロロ  
 - 4 - メトキシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [d]

ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

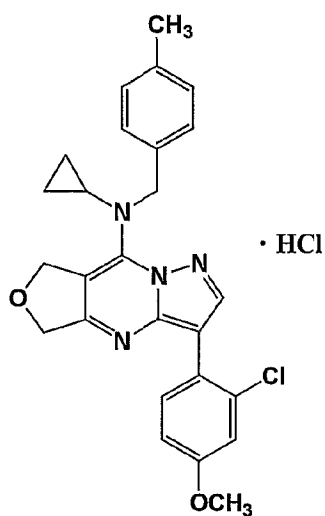


TLC : R<sub>f</sub> 0.61 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  8.27 (s, 1H), 7.71 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.04 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.94 (m, 1H), 3.90-3.70 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.64 (d, J = 6.6Hz, 2H), 3.30-3.12 (m, 2H), 3.12-2.96 (m, 2H), 2.32-2.12 (m, 2H), 1.68-1.50 (m, 2H), 1.46-1.20 (m, 2H), 1.06 (m, 1H), 0.91 (t, J = 7.2Hz, 3H), 0.62-0.46 (m, 2H), 0.24-0.10 (m, 2H)。

#### 10 実施例 2 (359)

8-(N-シクロプロピル-N-(4-メチルフェニル)メチルアミノ)-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

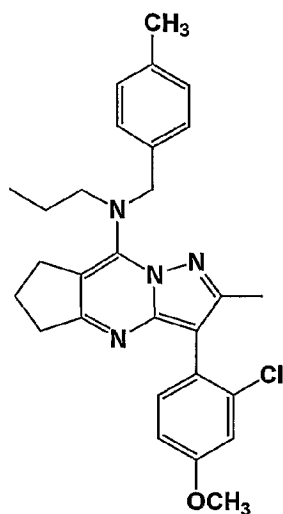


TLC : R<sub>f</sub> 0.49 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 8.42 (s, 1H), 7.76 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.09 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.06 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.99 (d, J = 8.1Hz, 2H), 6.93 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 5.19 (s, 2H), 5.11 (s, 2H), 4.96 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 2.58 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 0.86-0.76 (m, 4H)。

### 実施例 2 (360)

8 - (N-プロピル-N-(4-メチルフェニル)メチルアミノ) - 2-メ  
 10 チル - 3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5  
 H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

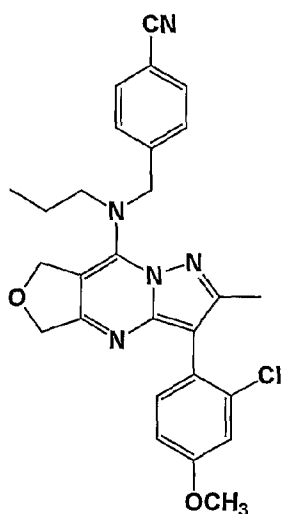


TLC : R<sub>f</sub> 0.74 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  7.32 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.16-7.06 (m, 4H), 7.07 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 8.7, 3.0Hz, 1H), 4.80 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.42-3.30 (m, 2H), 2.89 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.82 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 2.04-1.98 (m, 2H), 1.70-1.48 (m, 2H), 0.87 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

### 実施例 2 (361)

8 - (N-プロピル-N-(4-メチルフェニル)メチルアミノ) - 2-メ  
 10 チル - 3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 6, 7'-ジヒドロ-5  
 H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

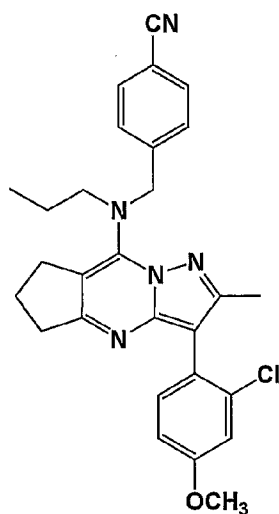


TLC : R<sub>f</sub> 0.38 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  7.64 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.50 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.30 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.90 (d, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.14 (s, 2H),  
 5 5.01 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.36-3.22 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 1.70-1.50 (m, 2H), 0.89 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

### 実施例 2 (362)

8 - (N-プロピル-N-(4-シアノフェニル)メチルアミノ) - 2-メ  
 10 チル - 3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5  
 H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン

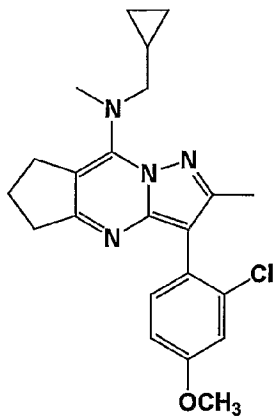


TLC : R<sub>f</sub> 0.46 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  7.61 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.47 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.31 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.90 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.44-3.32 (m, 2H), 2.92 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.88 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.38 (s, 3H), 2.20-2.02 (m, 2H), 1.66-1.46 (m, 2H), 0.88 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

### 実施例 2 (363)

8 - (N-シクロプロピルメチル-N-メチルアミノ) - 2 - メチル - 3 -  
 10 (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロ  
 ペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

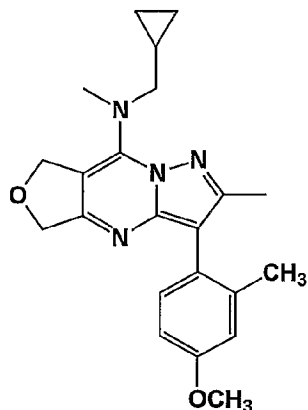


T L C : R f 0.30 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.30 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.05 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.88 (dd, J = 8.4, 3.0Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.61 (d, J = 6.9Hz, 2H), 3.30 (s, 3H), 3.12 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.92 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.20-2.06 (m, 2H), 1.09 (m, 1H),  
5 0.60-0.46 (m, 2H), 0.24-0.12 (m, 2H)。

### 実施例 2 ( 3 6 4 )

8 - (N-シクロプロピルメチル-N-メチルアミノ) - 2-メチル-3-  
(2-メチル-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ [3, 4  
10 - d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン



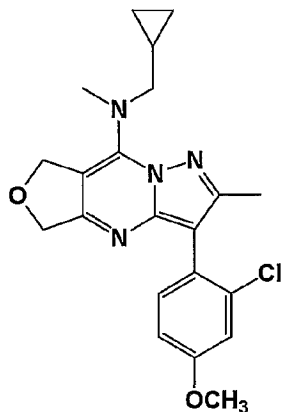
T L C : R f 0.22 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.16 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.87 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 8.4, 3.0Hz, 1H), 5.35 (s, 2H), 4.89 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.72 (dd, J = 6.9,  
15 1.5Hz, 2H), 3.27 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 2.15 (s, 3H), 1.10 (m, 1H), 0.60-0.48 (m, 2H), 0.24-0.14 (m, 2H)。

### 実施例 2 ( 3 6 5 )

8 - (N-シクロプロピルメチル-N-メチルアミノ) - 2-メチル-3-

(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

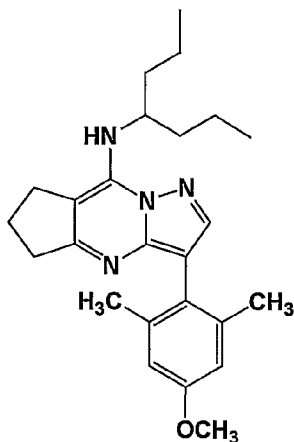


TLC: R<sub>f</sub> 0.18 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1);

- 5 NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 7.29 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.88 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 5.35 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.71 (d, J = 6.9Hz, 2H), 3.27 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 1.10 (m, 1H), 0.62-0.50 (m, 2H), 0.26-0.16 (m, 2H).

### 実施例2 (366)

- 10 8-(4-ヘプチルアミノ)-3-(2,6-ジメチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



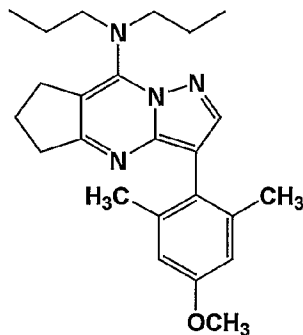
T L C : R f 0.55 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  7.80 (s, 1H), 6.83 (s, 2H), 6.27 (d, J = 11.1Hz, 1H), 3.98 (m, 1H), 3.80 (s, 3H), 3.11 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.22-2.04 (m, 2H), 2.13 (s, 6H), 1.76-1.30 (m, 8H), 0.96 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

5

### 実施例 2 (367)

8-ジプロピルアミノ-3-(2, 6-ジメチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン



10

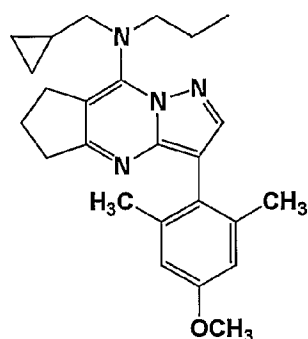
T L C : R f 0.54 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  7.86 (s, 1H), 6.69 (s, 2H), 3.80 (s, 3H), 3.64-3.46 (m, 4H), 2.98 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.92 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.22-2.00 (m, 2H), 2.12 (s, 6H), 1.68-1.48 (m, 4H), 0.89 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

15

### 実施例 2 (368)

8-(N-シクロプロピルメチル-N-プロピルアミノ)-3-(2, 6-ジメチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン

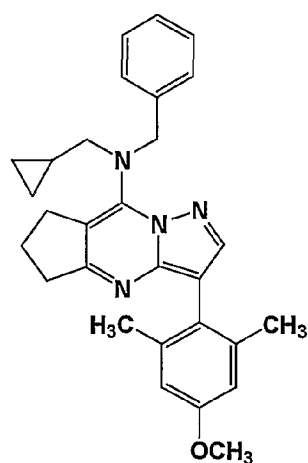


TLC : R f 0.51 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  7.86 (s, 1H), 6.69 (s, 2H), 3.80 (s, 3H), 3.68-3.58 (m, 2H), 3.54 (d, J = 6.6Hz, 2H), 3.03 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.93 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.04-2.00 (m, 2H), 2.12 (s, 6H), 1.68-1.50 (m, 2H), 1.02 (m, 1H), 0.91 (t, J = 7.5Hz, 3H), 0.54-0.40 (m, 2H), 0.18-0.04 (m, 2H)。

### 実施例 2 (369)

8 - (N-ベンジル-N-シクロプロピルメチルアミノ) - 3 - (2, 6-ジメチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペ  
 10    タ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン



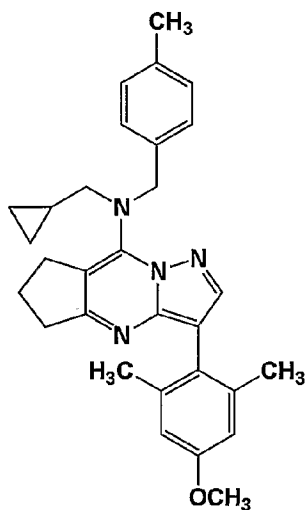
TLC : R f 0.49 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  7.93 (s, 1H), 7.42-7.08 (m, 5H), 6.70 (s, 2H), 4.94 (s, 2H), 3.81 (s, 3H), 3.41 (d, J = 6.6Hz, 2H), 3.02 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.92 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.22-2.04 (m, 2H), 2.13 (s, 6H), 1.03 (m, 1H), 0.54-0.38 (m, 2H), 0.12-0.01 (m, 2H)。

5

### 実施例 2 (370)

8 - (N-シクロプロピルメチル-N-(4-メチルフェニルメチル) アミノ) - 3 - (2, 6-ジメチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン



10

TLC : R<sub>f</sub> 0.53 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

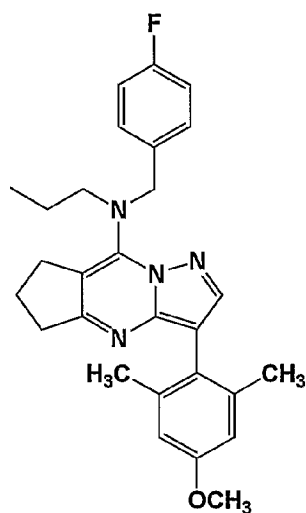
NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  7.92 (s, 1H), 7.21 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.11 (d, J = 8.1Hz, 2H), 6.70 (s, 2H), 4.89 (s, 2H), 3.81 (s, 3H), 3.40 (d, J = 6.9Hz, 2H), 3.02 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.92 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.22-2.04 (m, 2H), 2.13 (s, 6H), 1.03 (m, 1H), 0.54-0.40 (m, 2H), 0.10-0.01 (m, 2H)。

15

### 実施例 2 (371)

8 - (N-プロピル-N-(4-フルオロフェニルメチル) アミノ) - 3 -

(2, 6-ジメチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン

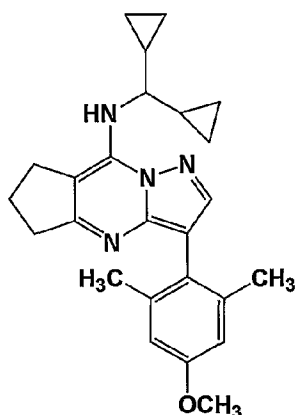


TLC : R<sub>f</sub> 0.46 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

- 5 NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  7.92 (s, 1H), 7.36-7.18 (m, 2H), 7.06-6.88 (m, 2H), 6.70 (s, 2H), 4.80 (s, 2H), 3.81 (s, 3H), 3.46-3.32 (m, 2H), 3.00-2.80 (m, 4H), 2.22-2.00 (m, 2H), 2.13 (s, 6H), 1.70-1.48 (m, 2H), 0.88 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

#### 実施例 2 (372)

- 10 8-ジシクロプロピルメチルアミノ-3-(2, 6-ジメチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン

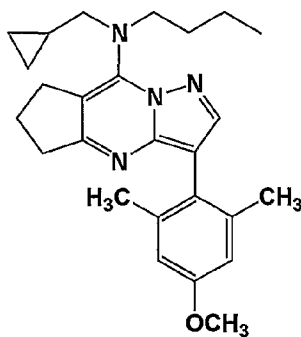


TLC : R f 0.45 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  7.81 (s, 1H), 6.68 (s, 2H), 6.40 (d, J = 9.9Hz, 1H),  
 3.80 (s, 3H), 3.46 (m, 1H), 3.05 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.89 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.22-2.02  
 5 (m, 2H), 2.13 (s, 6H), 1.20-1.06 (m, 2H), 0.68-0.36 (m, 8H)。

#### 実施例 2 ( 3 7 3 )

8 - (N-ブチル-N-シクロプロピルメチルアミノ) - 3 - (2, 6-ジ  
 メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ  
 10 [d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン



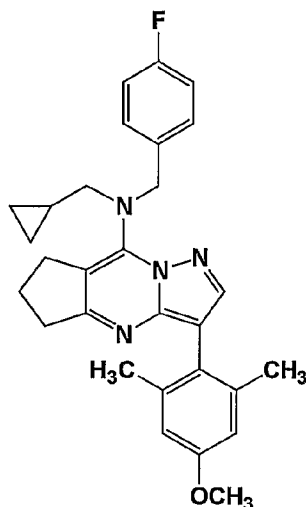
TLC : R f 0.61 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  7.87 (s, 1H), 6.69 (s, 2H), 3.80 (s, 3H), 3.76-3.60 (m,  
 2H), 3.53 (d, J = 6.9Hz, 2H), 3.03 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.93 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.22-

2.00 (m, 2H), 2.12 (s, 6H), 1.64-1.46 (m, 2H), 1.42-1.22 (m, 2H), 1.02 (m, 1H), 0.90 (t, J = 7.2Hz, 3H), 0.56-0.38 (m, 2H), 0.18-0.02 (m, 2H)。

### 実施例 2 (374)

- 5 8 - (N - シクロプロピルメチル - N - (4 - フルオロフェニル) メチルアミノ) - 3 - (2, 6 - ジメチル - 4 - メトキシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

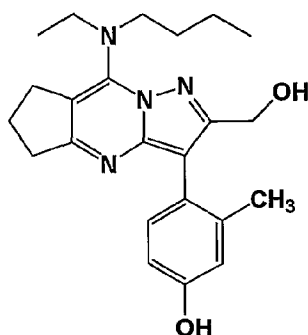


TLC : Rf 0.51 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

- 10 NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.92 (s, 1H), 7.38-7.26 (m, 2H), 7.06-6.94 (m, 2H), 6.71 (s, 2H), 4.89 (s, 2H), 3.81 (s, 3H), 3.39 (d, J = 6.6Hz, 2H), 3.02 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.93 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.22-2.00 (m, 2H), 2.13 (s, 6H), 1.01 (m, 1H), 0.54-0.40 (m, 2H), 0.10-0.01 (m, 2H)。

### 15 実施例 3

8 - (N - エチル - N - n - プチルアミノ) - 2 - ヒドロキシメチル - 3 - (2 - メチル - 4 - ヒドロキシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン



実施例 2 (1) で製造した化合物 (506 mg) の塩化メチレン (14 ml) 溶液を  $-78^{\circ}\text{C}$  に冷却し、1 M 三臭化ホウ素の塩化メチレン (12 ml) 溶液を加え、 $-78^{\circ}\text{C}$  で 30 分間、および  $-30^{\circ}\text{C}$  で 5 時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1 → 2 : 3) で精製して、以下の物性値を有する標題化合物 (303 mg) を得た。

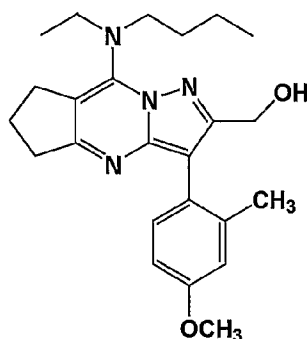
10 TLC : R<sub>f</sub> 0.14 (n-ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :  $\delta$  9.41 (brs, 1 H), 6.90 (d, J = 9.0Hz, 1 H), 6.42 (m, 2 H), 4.71 (brs, 2 H), 3.70 (q, J = 7.5Hz, 2 H), 3.64 (t, J = 7.5Hz, 2 H), 3.01 (t, J = 7.8Hz, 4 H), 2.39 (brs, 1 H), 2.18 (m, 2 H), 2.01 (s, 3 H), 1.58 (m, 2 H), 1.35 (m, 2 H), 1.21 (t, J = 7.5Hz, 3 H), 0.91 (t, J = 7.5Hz, 3 H)。

15

#### 実施例 4

8-(N-エチル-N-n-ブチルアミノ)-2-ヒドロキシメチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

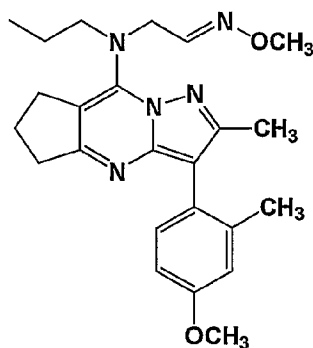


実施例 3 で製造した化合物 (985mg) の塩化メチレン (10ml) 溶液を、0℃に冷却し、水素化ナトリウム (95mg ; 63.1%油分散物) を加え、30分間攪拌した。反応混合物にヨウ化メチル (0.18ml) を加え、0℃で2  
5 時間攪拌した。反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を 1M水酸化ナトリウム水溶液および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (トルエン : 酢酸エチル = 5 : 1 → 4 : 1 → 7 : 2) で精製して、以下の物性値を有する標題化合物 (947mg) を得た。

- 10 TLC : R<sub>f</sub> 0.35 (n-ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;  
NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.19 (d, J = 8.4Hz, 1 H), 6.85 (d, J = 2.7Hz, 1 H), 6.78 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1 H), 4.73 (d, J = 5.7Hz, 2 H), 3.82 (s, 3 H), 3.65 (q, J = 7.2Hz, 2 H), 3.59 (t, J = 7.2Hz, 2 H), 2.98 (t, J = 6.9Hz, 2 H), 2.92 (t, J = 7.8Hz, 2 H), 2.35 (m, 1 H), 2.19 (s, 3 H), 2.15 (m, 2 H), 1.55 (m, 2 H), 1.35 (m, 2 H), 1.18 (t, J =  
15 7.2Hz, 3 H), 0.90 (t, J = 7.2Hz, 3 H)。

#### 実施例 5

- 8-(N-プロピル-N-(2-メトキシイミノエチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5  
20 H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



- 実施例 2 (2) で製造した化合物 (186 mg) のジメチルスルホキシド (5 ml) 溶液に、トリエチルアミン (0.39 ml) および三酸化硫黄ピリジン錯体 (225 mg) を加え、室温で 2 時間攪拌した。反応混合物を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣のピリジン (5 ml) 溶液に、*o*-メチルヒドロキシルアミン塩酸塩 (28 mg) を加え、室温で 15 時間攪拌した。反応混合物を濃縮し、酢酸エチルで希釈した。希釈液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン : 酢酸エチル = 4 : 1 → 3 : 1) で精製して、以下の物性値を有する標題化合物 (16 mg) を得た。

TLC : R<sub>f</sub> 0.78 (n-ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :

- 15 major isomer

δ 7.57 (t, J = 5.7Hz, 1H), 7.15 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 4.35 (d, J = 6.0Hz, 2H), 3.86 (s, 3H), 3.82 (s, 3H), 3.49 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.99 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.14 (m, 2H), 1.58 (m, 2H), 0.90 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

- 20 minor isomer

δ 7.15 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.95 (t, J = 3.9Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.79

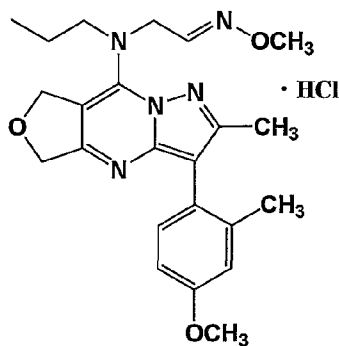
(dd,  $J = 8.4, 2.4\text{Hz}$ , 1H), 4.47 (d,  $J = 4.2\text{Hz}$ , 2H), 3.90 (s, 3H), 3.82 (s, 3H), 3.54 (t,  $J = 7.8\text{Hz}$ , 2H), 2.99 (t,  $J = 7.2\text{Hz}$ , 2H), 2.91 (t,  $J = 7.5\text{Hz}$ , 2H), 2.32 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.14 (m, 2H), 1.58 (m, 2H), 0.92 (t,  $J = 7.2\text{Hz}$ , 3H)。

# 5 実施例 5 (1) ~ 5 (2)

実施例 2 (26) で製造した化合物、または実施例 4 で製造した化合物および  $\alpha$ -メチルヒドロキシルアミン塩酸塩の代わりにヒドロキシルアミン塩酸塩を用いて実施例 5 と同様の操作を行なって、以下の化合物を得た。

# 10 実施例 5 (1)

8-(N-プロピル-N-(2-メトキシイミノエチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



15 TLC : R<sub>f</sub> 0.22 (n-ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR (300MHz, pyridine-d<sub>5</sub> 0.5ml + CDCl<sub>3</sub> 0.1ml) :

major isomer

$\delta$  7.87 (t,  $J = 5.4\text{Hz}$ , 1H), 7.38 (d,  $J = 8.4\text{Hz}$ , 1H), 7.03 (d,  $J = 2.7\text{Hz}$ , 1H), 6.95 (dd,  $J = 8.4, 2.7\text{Hz}$ , 1H), 5.27 (s, 2H), 4.97 (s, 2H), 4.59 (d,  $J = 5.4\text{Hz}$ , 2H), 3.86 (s, 3H),

20 3.74 (s, 3H), 3.38 (t,  $J = 7.5\text{Hz}$ , 2H), 2.44 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 1.65-1.50 (m, 2H),

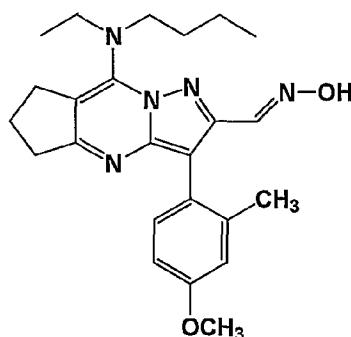
0.81 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

minor isomer

5  $\delta$  7.38 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.31 (t, J = 4.2Hz, 1H), 7.03 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.95 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 4.95 (s, 2H), 4.71 (d, J = 4.2Hz, 2H), 3.92 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 3.43 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 1.65-1.50 (m, 2H), 0.84 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

### 実施例 5 (2)

8 - (N-エチル-N-n-ブチルアミノ) - 2-ヒドロキシイミノメチル  
10 - 3 - (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-  
シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

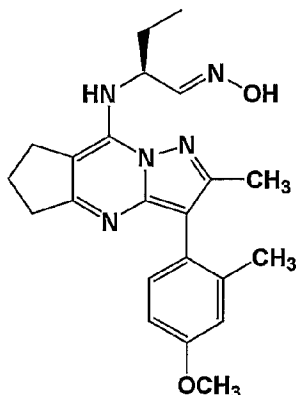


TLC : Rf 0.19 (n-ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  8.15 (s, 1H), 7.96 (brs, 1H), 7.18 (d, J = 8.1Hz, 1H),  
15 6.85 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.67 (q, J = 7.2Hz, 2H), 3.61 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.99 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.92 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.18 (s, 3H), 2.16 (m, 2H), 1.55 (m, 2H), 1.33 (m, 2H), 1.18 (t, J = 7.2Hz, 3H), 0.89 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

### 20 実施例 6

8-[(2S)-1-ヒドロキシイミノブタン-2-イル]アミノ-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



- 5 実施例 2 (15) で製造した化合物 (290 mg) の酢酸 (4 ml) 溶液に、1 M 塩酸 (1.4 ml) を加え、80℃で1時間攪拌した。反応混合物を、氷冷した飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (100 ml) に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣のピリジン (3 ml) 溶液に、ヒドロキシルアミン塩酸塩 (5
- 10 2 mg) を加え、室温で15時間攪拌した。反応混合物を濃縮した後、酢酸エチルで希釈した。希釈液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル=1：1) で精製して、以下の物性値を有する標題化合物 (143 mg) を異性体混合物として
- 15 て得た。

TLC : Rf 0.32 (n-ヘキサン：酢酸エチル=1：1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :

major isomer

δ 7.80 (brs, 1 H), 7.47 (d, J = 6.0Hz, 1 H), 7.14 (d, J = 8.4Hz, 1 H), 6.84 (d, J =

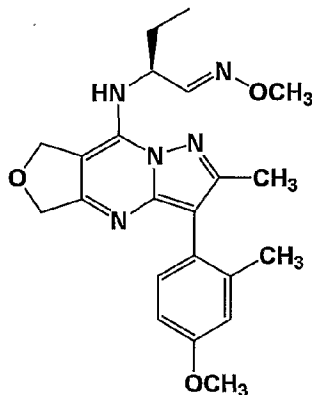
2.7Hz, 1 H), 6.78 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1 H), 6.53 (d, J = 9.6Hz, 1 H), 4.60 (m, 1 H), 3.82 (s, 3 H), 3.25-3.00 (m, 2 H), 2.88 (t, J = 7.5Hz, 2 H), 2.31 (s, 3 H), 2.17 (s, 3 H), 2.10 (m, 2 H), 1.90 (m, 2 H), 1.11 (t, J = 7.2Hz, 3 H)、

minor isomer

- 5  $\delta$  8.52 (brs, 1 H), 7.14 (d, J = 8.4Hz, 1 H), 6.84 (d, J = 2.7Hz, 1 H), 6.80 (m, 1 H), 6.78 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1 H), 6.44 (d, J = 9.6Hz, 1 H), 5.23 (m, 1 H), 3.82 (s, 3 H), 3.25-3.00 (m, 2 H), 2.88 (t, J = 7.5Hz, 2 H), 2.31 (s, 3 H), 2.17 (s, 3 H), 2.10 (m, 2 H), 1.90 (m, 2 H), 1.11 (t, J = 7.2Hz, 3 H)。

10 実施例 6 (1)

8-[(2S)-1-メトキシイミノブタン-2-イル]アミノ-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



- 15 実施例 2 (14) で製造した化合物 (365 mg)、およびヒドロキシルアミン塩酸塩の代わりに *o*-メチルヒドロキシルアミン塩酸塩を用いて、実施例 5 と同様にそうさを行なって、以下の物性値を有する標題化合物 (128 mg) を得た。

TLC: R<sub>f</sub> 0.20 (n-ヘキサン:酢酸エチル=3:1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :

major isomer

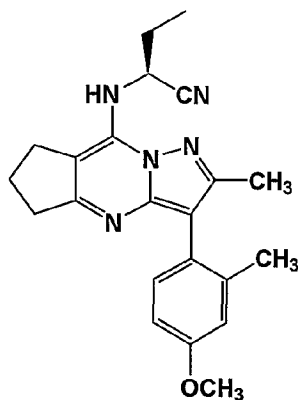
δ 7.36 (d, J = 6.0Hz, 1H), 7.14 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 6.60 (d, J = 9.9Hz, 1H), 5.47 (d, J = 10.5Hz, 1H), 5.31 (d, J = 10.5Hz, 1H), 4.89 (s, 2H), 4.07 (m, 1H), 3.86 (s, 3H), 3.82 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 2.16 (s, 3H), 1.96-1.87 (m, 2H), 1.10 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

minor isomer

δ 7.14 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 6.76 (m, 1H), 6.53 (d, J = 9.9Hz, 1H), 5.30 (m, 2H), 4.89 (s, 2H), 4.72 (m, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.82 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 2.16 (s, 3H), 1.96-1.87 (m, 2H), 1.10 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

#### 実施例 7

8 - [ ( 1 S ) - 1 - シアノプロピルアミノ ] - 2 - メチル - 3 - ( 2 - メチル - 4 - メトキシフェニル ) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペント [ d ] ピラゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリミジン

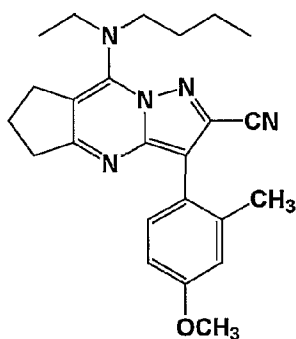


実施例 6 で製造した化合物 ( 1 3 7 m g ) の塩化メチレン ( 1 m l ) 溶液を - 7 8 ° C に冷却し、トリエチルアミン ( 0.32 m l ) およびトリフルオロメタ

- ンスルホン酸無水物 (0.13m l) を加え、室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン:酢酸エチル=3:1→2:1) で精製して、以下の物性値を有する標題化合物 (100mg) を得た。
- TLC: R<sub>f</sub> 0.27 (n-ヘキサン:酢酸エチル=2:1) ;
- NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 7.15 (d, J=8.1Hz, 1H), 6.86 (d, J=2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J=8.1, 2.7Hz, 1H), 6.50 (d, J=9.6Hz, 1H), 4.78 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.33 (ddd, J=14.4, 7.5, 6.3Hz, 1H), 3.11 (ddd, J=14.4, 8.1, 6.3Hz, 1H), 2.93 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.25-2.10 (m, 7H), 1.29 (t, J=7.5Hz, 3H)。

#### 実施例 7 (1)

- 8-(N-エチル-N-n-ブチルアミノ)-2-シアノ-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

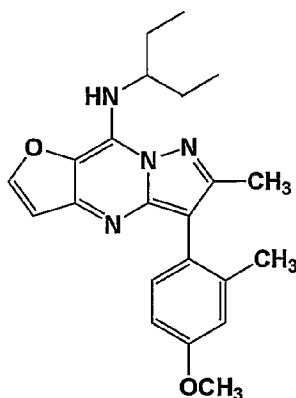


- 実施例 5 (2) で製造した化合物 (211mg) を用いて、実施例 7 と同様の操作を行なって以下の物性値を有する標題化合物 (195mg) を得た。
- TLC: R<sub>f</sub> 0.34 (n-ヘキサン:酢酸エチル=3:1) ;
- NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 7.28 (d, J=8.4Hz, 1H), 6.88 (d, J=2.7Hz, 1H), 6.83

(dd,  $J = 8.4, 2.7\text{Hz}$ , 1H), 3.83 (s, 3H), 3.65 (q,  $J = 6.9\text{Hz}$ , 2H), 3.58 (t,  $J = 7.5\text{Hz}$ , 2H), 3.00 (t,  $J = 7.2\text{Hz}$ , 2H), 2.96 (t,  $J = 7.8\text{Hz}$ , 2H), 2.29 (s, 3H), 2.18 (m, 2H), 1.57 (m, 2H), 1.33 (m, 2H), 1.20 (t,  $J = 6.9\text{Hz}$ , 3H), 0.91 (t,  $J = 7.2\text{Hz}$ , 3H)。

## 5 実施例 8

9 - (3 - ペンチルアミノ) - 6 - メチル - 5 - (2 - メチル - 4 - メトキシフェニル) - フロ [3, 2 - d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン



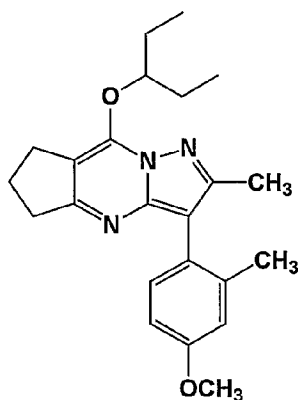
実施例 2 (6) で製造した化合物 (215 mg) のジフェニルエーテル (3  
10 ml) 溶液に、10%パラジウム炭素 (150 mg) を加え、250℃で4  
時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、メタノール (10 ml) で希  
釈し、セライトろ過した。ろ液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマト  
グラフィ (n-ヘキサン : アセトン = 9 : 1) で精製して、以下の物性値  
を有する標題化合物 (150 mg) を得た。

15 TLC : R<sub>f</sub> 0.42 (n-ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  7.76 (d,  $J = 2.4\text{Hz}$ , 1H), 7.20 (d,  $J = 8.1\text{Hz}$ , 1H), 6.88  
(d,  $J = 2.7\text{Hz}$ , 1H), 6.80 (dd,  $J = 8.1, 2.7\text{Hz}$ , 1H), 6.78 (d,  $J = 2.4\text{Hz}$ , 1H), 6.28 (brd,  $J$   
= 10.2Hz, 1H), 4.30 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 2.21 (s, 3H), 1.92-1.65 (m,  
4H), 1.05 (m, 6H)。

実施例 9

8 - (3 - ペンチルオキシ) - 2 - メチル - 3 - (2 - メチル - 4 - メトキシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン



水素化ナトリウム (92.0mg ; 60% in oil) のトルエン溶液に、3 - ペンタノール (202mg) を滴下し、80℃で2分間攪拌した。この混合物に、参考例7で製造した化合物 (250mg) を加え、5時間攪拌した。反応溶液に水および酢酸エチルを加え、攪拌後、有機層を分離した。さらに、水層を酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン : 酢酸エチル = 5 : 1) で精製し、以下の物性値を有する標題化合物 (128mg) を得た。

15 TLC : R<sub>f</sub> 0.58 (トルエン : アセトン = 5 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.16 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.05 (quint, J = 6.0Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.05 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.94 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.22 - 2.10 (m, 2H), 2.16 (s, 3H), 1.92 - 1.78 (m, 4H), 1.05 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

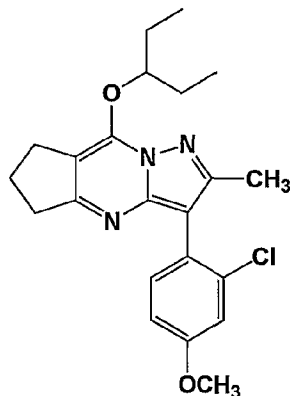
実施例 9 (1) ~ 9 (5)

相当する化合物を用いて、実施例 9 と同様の操作を行なうことによって以下の化合物を得た。

5

実施例 9 (1)

8 - (3 - ペンチルオキシ) - 2 - メチル - 3 - (2 - クロロ - 4 - メトキシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン



10

TLC : R<sub>f</sub> 0.50 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

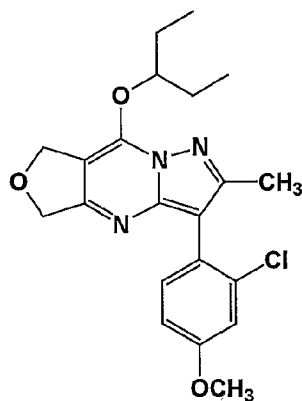
NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.29 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.06 (quint, J = 6.0Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.05 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.95 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.38 (s, 3H), 2.16 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.94 - 1.74 (m, 4H), 1.04 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

15

実施例 9 (2)

8 - (3 - ペンチルオキシ) - 2 - メチル - 3 - (2 - クロロ - 4 - メトキシフェニル) - 5, 7 - ジヒドロ - フロ [3, 4 - d] ピラゾロ [1, 5 -

a] ピリミジン

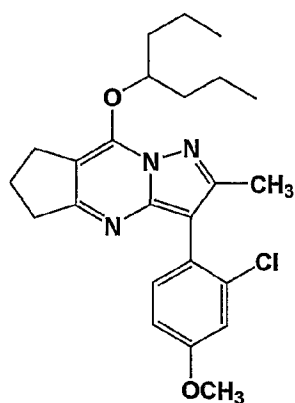


TLC : R f 0.25 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  7.28 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.90  
 5 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.29 (s, 2H), 4.93 (s, 2H), 4.56 (m, 1H), 3.84 (s, 3H), 2.41 (s,  
 3H), 1.99 - 1.80 (m, 4H), 1.05 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

### 実施例 9 (3)

8 - (4 - ヘプチルオキシ) - 2 - メチル - 3 - (2 - クロロ - 5 - メトキシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1,  
 10 5 - a] ピリミジン



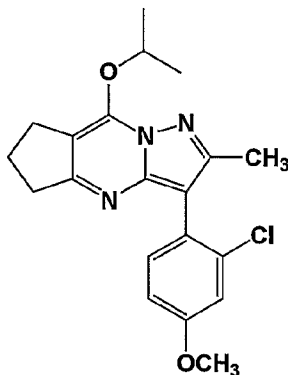
TLC : R f 0.85 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR(300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :  $\delta$  7.29 (d,  $J = 8.7\text{Hz}$ , 1H), 7.06 (d,  $J = 2.7\text{Hz}$ , 1H), 6.89 (dd,  $J = 8.7, 2.7\text{Hz}$ , 1H), 5.22 (quint,  $J = 6.0\text{Hz}$ , 1H), 3.83 (s, 3H), 3.05 (t,  $J = 7.5\text{Hz}$ , 2H), 2.95 (t,  $J = 7.5\text{Hz}$ , 2H), 2.37 (s, 3H), 2.16 (quint,  $J = 7.5\text{Hz}$ , 2H), 1.90 - 1.66 (m, 4H), 1.58 - 1.42 (m, 4H), 0.95 (t,  $J = 7.2\text{Hz}$ , 6H)。

5

#### 実施例 9 (4)

8-イソプロピルオキシ-2-メチル-3-(2-クロロ-5-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



10

TLC : Rf 0.36 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

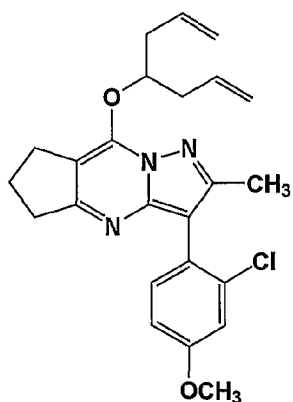
NMR(300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :  $\delta$  7.29 (d,  $J = 8.4\text{Hz}$ , 1H), 7.06 (d,  $J = 2.4\text{Hz}$ , 1H), 6.89 (dd,  $J = 8.4, 2.4\text{Hz}$ , 1H), 5.43 (sept,  $J = 6.3\text{Hz}$ , 1H), 3.83 (s, 3H), 3.06 (t,  $J = 7.5\text{Hz}$ , 2H), 2.96 (t,  $J = 7.5\text{Hz}$ , 2H), 2.38 (s, 3H), 2.16 (quint,  $J = 7.5\text{Hz}$ , 2H), 1.51 (d,  $J = 6.3\text{Hz}$ , 6H)。

15

#### 実施例 9 (5)

8-(1,6-ヘプタジエン-4-イル)オキシ-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

20

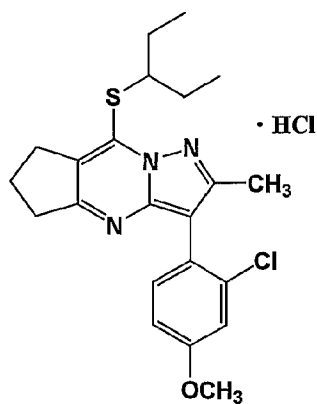


T L C : R f 0.58 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  7.29(d, J = 8.4Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.90 (ddt, J = 17.1, 10.2, 6.9Hz, 2H), 5.34 (quint, J = 6.3Hz, 1H), 5.17 (m, 2H), 5.11 (dd, m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.01 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.95 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.70 - 2.50 (m, 4H), 2.38 (s, 3H), 2.15 (quint, J = 7.5Hz, 2H)。

#### 実施例 10

8 - (3 - ペンチルチオ) - 2 - メチル - 3 - (2 - クロロ - 5 - メトキシ  
10 フェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1,  
5 - a] ピリミジン・塩酸塩



水素化ナトリウム (68.9mg ; 60% in oil) のエタノール (17ml) 溶

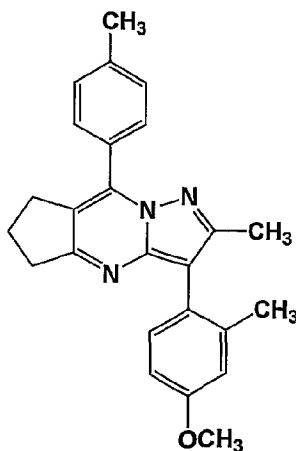
- 液に、0℃で、3-アセチルチオペンタン（252mg）および参考例7で製造した化合物（300mg）を加え、1時間攪拌した。反応溶液を濃縮し、水および酢酸エチルを加え、攪拌し有機層を分離した。さらに、水層を酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝5：1）で精製した。精製物に0℃で4N塩酸-酢酸エチル（0.2ml）を加え、10分間攪拌し、その後濃縮して、以下の物性値を有する標題化合物（271.1mg）を得た。

TLC：Rf 0.57（ヘキサン：酢酸エチル＝2：1）；

- 10 NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>)：δ 7.29 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 4.27 (quint, J = 6.3Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.05 (t, J = 7.5Hz, 2H), 3.00 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.40 (s, 3H), 2.17 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.72 - 1.64 (m, 4H), 1.02 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

# 15 実施例 11

8-(4-メチルフェニル)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



参考例 7 で製造した化合物 (300 mg) のジメトキシエタン (3 ml) 溶液に、4-メチルフェニルボロン酸 (131 mg)、酢酸パラジウム (11 mg)、トリフェニルホスフィン (48 mg) および飽和炭酸ナトリウム水溶液 (2 ml) を加え、5 時間加熱還流した。反応溶液を冷却し、酢酸エチルで希釈した。希釈液を飽和食塩水および水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル=5：1) で精製して、以下の物性値を有する標題化合物 (222 mg) を得た。

TLC : R<sub>f</sub> 0.41 (ヘキサン：酢酸エチル=3：1) ;

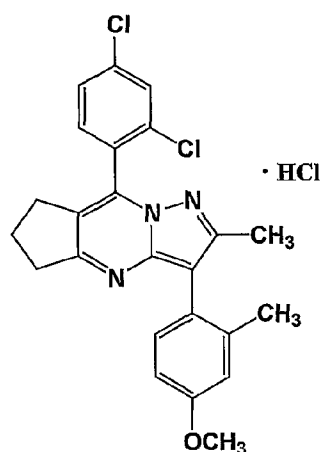
10 NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.72 (d, J=8.1Hz, 2H), 7.36 (d, J=8.1Hz, 2H), 7.19 (d, J=8.4Hz, 1H), 6.88 (d, J=2.7Hz, 1H), 6.81 (dd, J=2.7, 8.4Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.01 (t, J=7.5Hz, 2H), 2.94 (t, J=6.6Hz, 2H), 2.45 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 2.14 (m, 2H)。

#### 15 実施例 11 (1) ~ 11 (5)

相当する化合物を用いて、実施例 11 と同様の操作を行なうことによって以下の化合物を得た。

#### 実施例 11 (1)

20 8-(2, 4-ジクロロフェニル)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

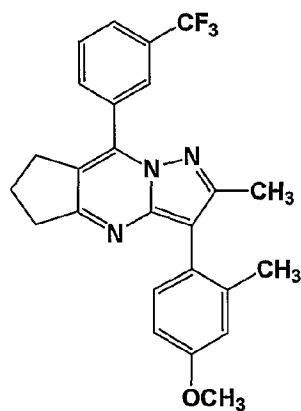


TLC : R<sub>f</sub> TLC : R<sub>f</sub> 0.38 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR(300MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) : δ 7.91 (d, J = 1.8Hz, 1H), 7.70 (d, J = 8.4Hz, 1H),  
 7.64 (dd, J = 1.8, 8.4Hz, 1H), 7.11 (br d, J = 8.1Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.7Hz, 1H),  
 5 6.81 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 3.77 (s, 3H), 2.94 (m, 2H), 2.68 (m, 2H), 2.14 (s, 3H),  
 2.12 (m, 2H), 2.09 (s, 3H)。

#### 実施例 11 (2)

8 - (3 - トリフルオロメチルフェニル) - 2 - メチル - 3 - (2 - メチル  
 10 - 4 - メトキシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ [d]  
 ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン

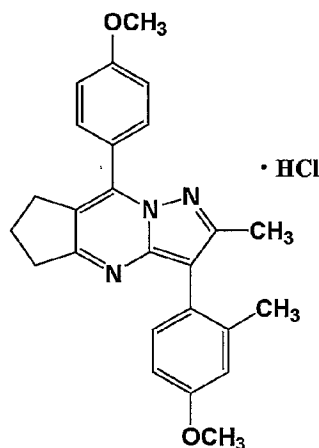


TLC : R<sub>f</sub> 0.27 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 8.08 (brs, 1 H), 8.06 (brd, J = 8.1Hz, 1 H), 7.79 (brd, J = 7.8Hz, 1 H), 7.70 (brdd, J = 8.1, 7.8Hz, 1 H), 7.19 (d, J = 8.1Hz, 1 H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1 H), 6.82 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1 H), 3.84 (s, 3 H), 3.04 (t, J = 7.5Hz, 2 H),  
 5 2.94 (t, J = 7.5Hz, 2 H), 2.31 (s, 3 H), 2.20 (s, 3 H), 2.18 (m, 2 H)。

### 実施例 11 (3)

8 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - メチル - 3 - (2 - メチル - 4 - メトキシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1,  
 10 5 - a] ピリミジン・塩酸塩



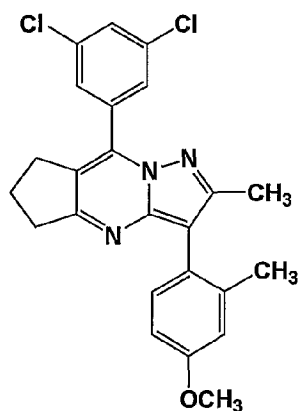
TLC : R<sub>f</sub> 0.23 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 7.92 (d, J = 9.0Hz, 2 H), 7.16 (d, J = 9.0Hz, 2 H), 7.16 (d, J = 9.0Hz, 1 H), 6.92 (d, J = 2.7Hz, 1 H), 6.86 (dd, J = 9.0, 2.7Hz, 1 H), 3.95 (s, 3 H), 3.85 (s, 3 H), 3.61 (t, J = 7.5Hz, 2 H), 3.09 (t, J = 7.5Hz, 2 H), 2.38 (s, 3 H), 2.30 (m, 2 H), 2.20 (s, 3 H)。

### 実施例 11 (4)

8 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 2 - メチル - 3 - (2 - メチル - 4 -

メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾ  
ロ [1, 5-a] ピリミジン

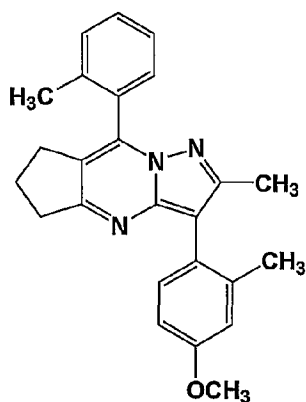


TLC: R<sub>f</sub> 0.50 (ヘキサン: 酢酸エチル = 3 : 1) ;

- 5 NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 7.69 (d, J = 1.8Hz, 2H), 7.52 (t, J = 1.8Hz, 1H), 7.17 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.02 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.93 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.17 (m, 2H)。

#### 10 実施例 11 (5)

8-(2-メチルフェニル)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

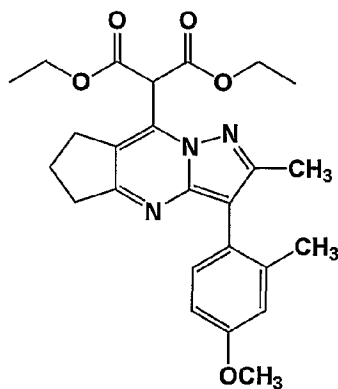


TLC : R<sub>f</sub> 0.38 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  7.34 - 7.48 (m, 4H), 7.20 (m, 1H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 2.7, 8.1Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.04 (m, 2H), 2.81 (m, 1H), 2.62 (m, 1H), 2.27 (s, 3H), 2.20 (m, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.15 (m, 2H)。

### 実施例 12

8-ビス (エトキシカルボニル) メチルー 2-メチルー 3- (2-メチルー 4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン



水素化ナトリウム (210mg ; 63.1% in oil) のテトラヒドロフラン (10ml) 懸濁液に、マロン酸ジエチル (880mg) を加え、室温で30分

間攪拌した。反応溶液に、参考例 7 で製造した化合物 (820 mg) を加え、  
4 時間加熱還流した。反応溶液に飽和塩化アンモニウム水溶液 (10 ml)  
を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナ  
トリウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー  
5 (ヘキサン：酢酸エチル＝8：1→7：1) で精製して、以下の物性値を有  
する標題化合物 (1.10 g) を得た。

TLC : R<sub>f</sub> 0.48 (ヘキサン：酢酸エチル＝2：1) ;

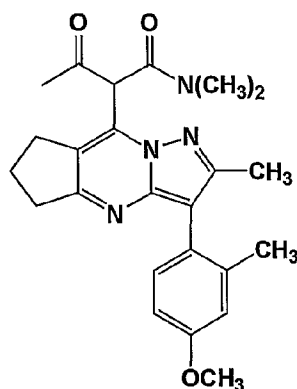
NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  7.15 (d, J = 8.1Hz, 1 H), 6.87 (d, J = 3.0Hz, 1 H), 6.80  
(dd, J = 8.1, 3.0Hz, 1 H), 6.02 (s, 1 H), 4.32 (m, 4 H), 3.82 (s, 3 H), 2.96 (t, J = 7.8Hz,  
10 2 H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 2 H), 2.32 (s, 3 H), 2.21 - 2.09 (m, 2 H), 2.17 (s, 3 H), 1.32  
(t, J = 7.2Hz, 6 H)。

#### 実施例 12 (1) ～ 12 (4)

相当する化合物を用いて、実施例 12 と同様の操作を行なうことによって  
15 以下の化合物を得た。

#### 実施例 12 (1)

8 - (1 - ジメチルアミノ - 1, 3 - ジオキソ - 2 - プチル) - 2 - メチル  
- 3 - (2 - メチル - 4 - メトキシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5 H -  
20 シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン

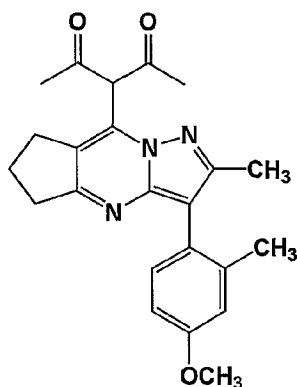


T L C : R f 0.55 (酢酸エチル) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 7.14 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.87 (d, J = 1.8Hz, 1H), 6.83 - 6.74 (m, 1H), 6.29 (s, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.05 (s, 3H), 3.05 - 2.60 (m, 6H), 2.41 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 2.16 (brs, 6H)。

#### 実施例 12 (2)

8 - (2, 4 - ジオキソ - 3 - ペンチル) - 2 - メチル - 3 - (2 - メチル - 4 - メトキシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン



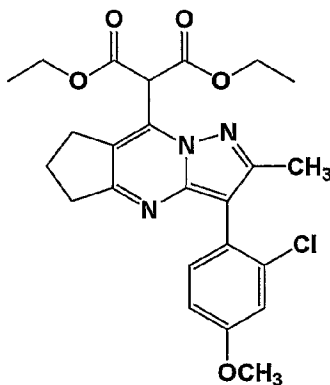
T L C : R f 0.34 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 16.93 (s, 1H), 7.19 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 8.4, 3.0Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.04 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.81

(t,  $J = 7.2\text{Hz}$ , 2H), 2.33 (s, 3H), 2.20 (quint,  $J = 7.2\text{Hz}$ , 2H), 2.18 (s, 3H), 1.95 (s, 6H)。

### 実施例 12 (3)

- 5 8-ビス (エトキシカルボニル) メチルー 2-メチルー 3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

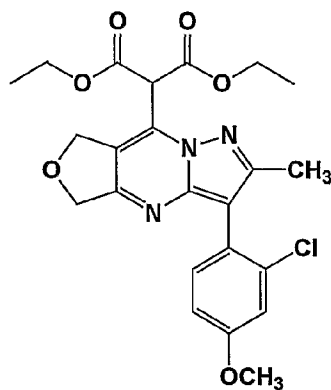


TLC : R<sub>f</sub> 0.18 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

- 10 NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  7.28 (d,  $J = 8.4\text{Hz}$ , 1H), 7.07 (d,  $J = 2.4\text{Hz}$ , 1H), 6.89 (dd,  $J = 8.4, 2.4\text{Hz}$ , 1H), 6.02 (s, 1H), 4.40 - 4.20 (m, 4H), 3.84 (s, 3H), 2.98 (t,  $J = 7.5\text{Hz}$ , 2H), 2.92 (t,  $J = 7.5\text{Hz}$ , 2H), 2.35 (s, 3H), 2.17 (quint,  $J = 7.5\text{Hz}$ , 2H), 1.31 (t,  $J = 7.2\text{Hz}$ , 6H)。

### 15 実施例 12 (4)

8-ビス (エトキシカルボニル) メチルー 2-メチルー 3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) -5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

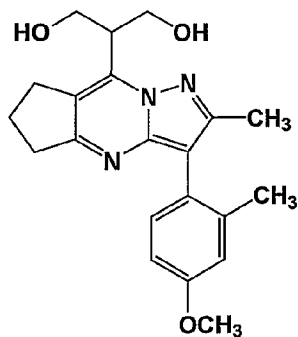


TLC : R f 0.28 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  7.28 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 6.12 (s, 1H), 5.11 (s, 2H), 4.95 (s, 2H), 4.41 - 4.20 (m, 4H),  
 5 3.84 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 1.33 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

### 実施例 13

8 - (1, 3-ヒドロキシ-2-プロピル) - 2-メチル-3 - (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d]  
 10 ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン



アルゴン雰囲気下、実施例 12 で製造した化合物 (355mg) の脱水ジエチルエーテル (7ml) 溶液に、-78℃で 1M ジイソプロピルアルミニウムヒドライド (3.94ml ; ヘキサン溶液) を滴下した。混合溶液を 0℃に昇温

し、4.5 時間攪拌した。反応溶液にメタノール（3 m l）を滴下し、室温に昇温した。反応溶液に 1 N 塩酸水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝3：1）で精製し、以下の物性値を有する標題化合物（260 m g）を得た。

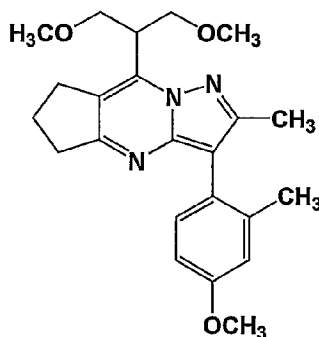
T L C : R f 0.50（クロロホルム：メタノール＝9：1）；

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  7.13 (brd, J = 8.7Hz, 1H), 6.87 (s, 1H), 6.80 (brd, J = 8.7Hz, 1H), 4.97 (m, 1H), 4.90 (m, 1H), 4.24 (m, 2H), 4.13 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.59 (m, 1H), 2.98 (brt, J = 7.2Hz, 4H), 2.31 (s, 3H), 2.28-2.00 (m, 5H)。

10

#### 実施例 1 4

8 - (1, 3 - ジメトキシ - 2 - プロピル) - 2 - メチル - 3 - (2 - メチル - 4 - メトキシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン



15

水素化ナトリウム（26.0 m g ; 60 % in oil）の DMF 溶液に、0 °C で実施例 1 3 で製造した化合物（120 m g）の DMF（2 m l）溶液を滴下した。この混合物にヨウ化メチル（81.0  $\mu$  l）を滴下し、1 時間攪拌した。反応溶液に水および酢酸エチルを加え、有機層を分離した。さらに、水層を酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウム

20

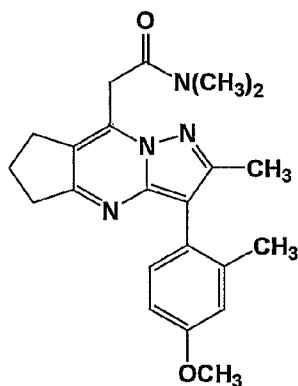
で乾燥後、ベンゼン（5 ml）を加えてから濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝3：1）で精製して、以下の物性値を有する標題化合物（58.7 mg）を得た。

TLC：R<sub>f</sub> 0.80（酢酸エチル）；

- 5 NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>)：δ 7.15 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 4.28 - 4.16 (m, 1H), 4.14 - 4.06 (m, 2H), 3.96 - 3.86 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.35 (s, 6H), 3.06 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.94 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.17 - 2.08 (m, 2H)。

#### 10 実施例 15

8 - (N, N-ジメチルカルバモイルメチル) - 2 - メチル - 3 - (2 - メチル - 4 - メトキシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン



- 15 実施例 12 で製造した化合物（410 mg）のメタノール（1 ml）溶液に、24℃でジメチルアミノ（491 mg）の50%水溶液を加え、90℃で20時間攪拌した。反応溶液を室温まで冷却し、水および酢酸エチルを加え、攪拌後、有機層を分離した。さらに、水層を酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。
- 20 た。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝

5 : 1) で精製して、以下の物性値を有する標題化合物 (102.7mg) を得た。

TLC : R<sub>f</sub> 0.55 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

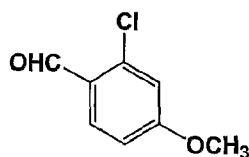
NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  7.16 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.87 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.80

(dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.27 (d, J = 1.2Hz, 1H), 3.04 - 2.94 (m, 5H),

5 2.72 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 2.24 - 2.10 (m, 8H)。

### 参考例 8

2-クロロ-4-メトキシベンズアルデヒド



10 水素化ナトリウム (2.6 g ; 62.6% in oil) のジメチルホルムアミド (80 ml

1) 懸濁液に、0℃で2-クロロ-4-ヒドロキシベンズアルデヒド (10.0

g) のジメチルホルムアミド (50 ml) 溶液を15分かけて滴下し、30

分間攪拌した。反応溶液に、0℃でヨウ化メチル (4.2ml) を10分かけて

滴下し、1時間攪拌した。反応溶液を水に注ぎ、ヘキサン/酢酸エチル (1 :

15 1) で抽出した。有機層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシ

ウムで乾燥後、濃縮して、以下の物性値を有する標題化合物 (10.7 g) を得た。

TLC : R<sub>f</sub> 0.61 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

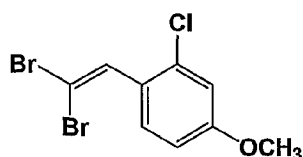
NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  10.33 (d, J = 0.6Hz, 1H), 7.90 (d, J = 9.0Hz, 1H), 6.94

(d, J = 2.4Hz, 1H), 6.89 (ddd, J = 9.0, 2.4, 0.6Hz, 1H), 3.89 (s, 3H)。

20

### 参考例 9

1- (2, 2-ジブロモエテニル) -2-クロロ-4-メトキシベンゼン



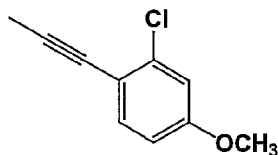
参考例 8 で製造した化合物 (5.0 g) の塩化メチレン (140 ml) 溶液に、四臭化炭素 (10.7 g) を加え、氷浴下、トリフェニルホスフィン (16.9 g) を内温 5℃以下を保ちながら少しずつ加えた。混合物を 0℃で 30 分間撹拌した。反応混合物のヘキサン (500 ml) 懸濁液を、シリカゲル (30 g) に注ぎ、ろ過した。シリカゲルをヘキサン/酢酸エチル (10 : 1) で洗浄した。ろ液および洗浄液を合わせ、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン : 酢酸エチル = 10 : 1) で精製して、以下の物性値を有する標題化合物 (6.6 g) を得た。

10 TLC : R<sub>f</sub> 0.82 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.62 (d, J = 9.0Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 6.94 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 9.0, 2.1Hz, 1H), 3.81 (s, 3H)。

#### 参考例 10

15 1 - (1 - プロピニル) - 2 - クロロ - 5 - メトキシベンゼン



参考例 9 で製造した化合物 (1.98 g) のテトラヒドロフラン (20 ml) 溶液に、-78℃で 1.57M の n - ブチルリチウムヘキサン溶液 (8.2 ml) を加え、30 分間撹拌し、0℃で 1 時間撹拌した。反応溶液を再び -78℃に冷却し、ヨウ化メチル (0.46 ml) を加え、0℃で 1 時間撹拌した。反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸

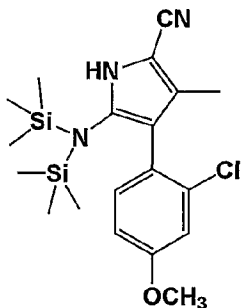
マグネシウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝１０：１）で精製して、以下の物性を有する標題化合物（０.８９ ｇ）を得た。

TLC : R<sub>f</sub> 0.69（ヘキサン：酢酸エチル＝５：１）；

- 5 NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.34 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.91 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.73 (d, J = 8.7Hz, 2.7Hz, 1H), 3.79 (s, 3H), 2.10 (s, 3H)。

### 参考例 11

- 5ービス（トリメチルシリル）アミノー２ーシアノー３ーメチルー４ー（２  
10 ークロロー４ーメトキシフェニル）ピロール



- 30分間加熱乾燥した塩化ニッケル（832 g）に、アルゴン置換下、ジイソブチルアルミニウムヒドリド（13.8m l）を室温でゆっくり加え、15分間攪拌した。反応溶液が黒変した後、参考例10で製造した化合物（11.6 g）  
15 のトリメチルシリルシアニド（46m l）溶液を25分かけて加えた。混合溶液を加熱し、ヘキサンを留去した後、130℃で2時間半攪拌した。反応溶液を室温まで冷却し、塩化メチレンで希釈した。希釈液をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝１０：１）で精製して、以下の物性値を有する標題化合物（9.5 g）、および副生成物として２ービス（トリメチルシリル）アミノー５ーシアノー３ーメチルー４ー（２ークロロー４ーメトキシフェニル）ピロール（5.2 g）を得た。

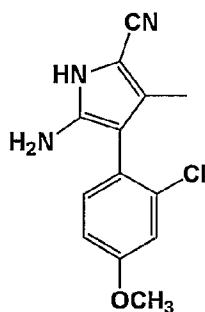
TLC : R f 0.34 (ヘキサン : 酢酸エチル = 10 : 1) ;

NMR(300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :  $\delta$  7.76 (brs, 1H), 7.10 (d,  $J = 8.4\text{Hz}$ , 1H), 7.00 (d,  $J = 2.7\text{Hz}$ , 1H), 6.82 (dd,  $J = 8.4, 2.7\text{Hz}$ , 1H), 3.83 (s, 3H), 2.06 (s, 3H), 0.14 (s, 9H), -0.14 (s, 9H)。

5

### 参考例 1 2

5-アミノ-2-シアノ-3-メチル-4-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)ピロール



- 10 参考例 1 1 で製造した化合物 (6.27 g) のメタノール (50 ml) 溶液に、1 N 水酸化ナトリウム水溶液 (15.4 ml) を室温で加え、1 時間半加熱還流した。反応溶液を室温まで冷却後、炭酸ナトリウム水溶液に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮して、以下の物性値を有する標題化合物 (4.78 g) を得た。

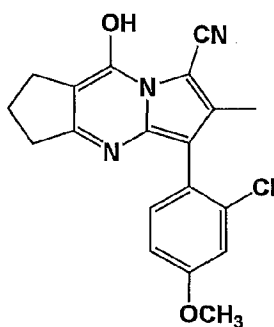
- 15 TLC : R f 0.20 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR(300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :  $\delta$  8.61 (brs, 1H), 7.14 (d,  $J = 8.7\text{Hz}$ , 1H), 7.03 (d,  $J = 2.4\text{Hz}$ , 1H), 6.86 (dd,  $J = 8.7, 2.4\text{Hz}$ , 1H), 3.83 (s, 3H), 3.71 (brs, 2H), 2.04 (s, 3H)。

### 実施例 1 6

- 20 1-シアノ-2-メチル-8-ヒドロキシ-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピロロ [1,

2-a] ピリミジン



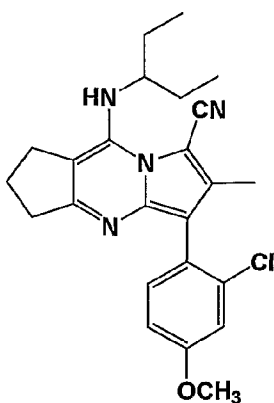
参考例 12 で製造した化合物 (4.15 g) を用いて、実施例 1 と同様の操作を行なうことによって、以下の物性値を有する標題化合物 (1.35 g) を得た。

5 TLC : R<sub>f</sub> 0.15 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR (300MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) :  $\delta$  12.25 (brs, 1H), 7.31 (d, J = 7.8Hz, 1H), 7.20 (d, J = 2.7Hz, 1H), 7.02 (dd, J = 7.8, 2.7Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 2.83 (m, 2H), 2.66 (m, 2H), 2.06 (s, 3H), 2.03 (m, 2H)。

#### 10 実施例 17

1-シアノ-2-メチル-8-(3-ペンチルアミノ)-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピロロ[1,2-a]ピリミジン



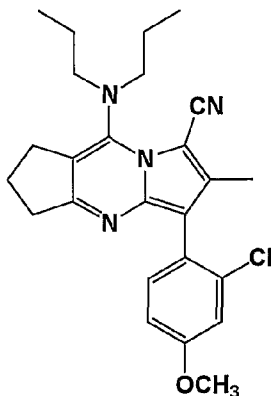
実施例 16 で製造した化合物を用いて、参考例 7 と同様の操作を行なうことによって製造した 1-シアノ-2-メチル-8-クロロ-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピロロ[1,2-a]ピリミジン (180mg) を用いて、実施例 2 と同様の  
5 の操作を行なうことによって、以下の物性値を有する標題化合物 (112mg) を得た。

TLC: R<sub>f</sub> 0.36 (トルエン:酢酸エチル=9:1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 7.25 (d, J=8.4Hz, 1H), 7.05 (d, J=2.4Hz, 1H), 6.88 (dd, J=8.4, 2.4Hz, 1H), 5.94 (d, J=9.0Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.82 (m, 1H), 3.04 (m,  
10 2H), 2.87 (m, 2H), 2.29 (s, 3H), 2.11 (m, 2H), 1.82-1.60 (m, 4H), 1.04 (t, J=7.5Hz, 3H), 1.03 (t, J=7.5Hz, 3H)。

#### 実施例 17 (1)

1-シアノ-2-メチル-8-ジプロピルアミノ-3-(2-クロロ-4-  
15 メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピロロ[1,2-a]ピリミジン



相当する化合物を用いて参考例 8 → 参考例 9 → 参考例 10 → 参考例 11 →

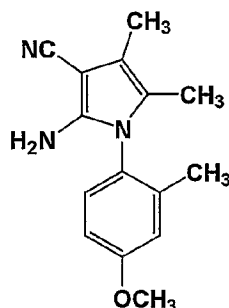
参考例 1 2 → 実施例 1 6 → 実施例 1 7 と同様の操作を行うことによって以下の物性値を有する標題化合物を得た。

T L C : R f 0.39 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  7.26 (d, J = 8.1Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.89  
5 (dd, J = 8.1, 2.4Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.35-3.13 (m, 4H), 3.00-2.80 (m, 4H), 2.32 (s, 3H), 2.14 (m, 2H), 1.81-1.38 (m, 4H), 0.91 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

### 参考例 1 3

5-アミノ-4-シアノ-2, 3-ジメチル-1-(2-メチル-4-メト  
10 キシフェニル) ピロール



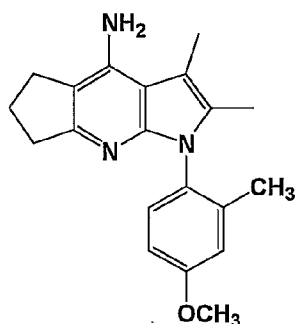
2-メチル-4-メトキシアニリン (10 g) のトルエン (120 ml)  
溶液に、アセトイン (6.43 g) および p-トルエンスルホン酸・水和物 (44  
mg) を加え、混合物を 2 時間加熱還流した。反応混合物を室温まで冷却後、  
15 マロノニトリル (4.6 ml) を加え、12 時間加熱還流した。冷却した反応溶  
液を濃縮し、残渣をエーテルで希釈した後、析出物をろ取して、以下の物性  
値を有する標題化合物 (5.73 g) を得た。

T L C : R f 0.65 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  7.07 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.87 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.82  
20 (dd, J = 3.0, 8.4Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.71 (brs, 2H), 2.06 (s, 3H), 1.99 (s, 3H), 1.73  
(s, 3H)。

実施例 1 8

2, 3-ジメチル-4-アミノ-1-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[e]ピロロ[2, 3-b]ピリジン

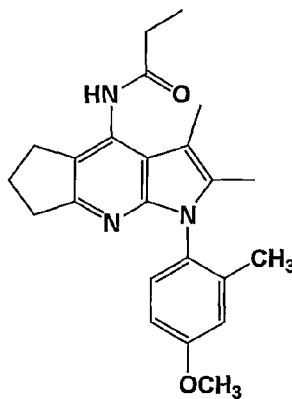


参考例 1 3 で製造した化合物 (4.0 g) のベンゼン (40 ml) 溶液に、シクロペンタノン (1.46 ml) および p-トルエンスルホン酸・水和物 (40 mg) を加え、脱水しながら 12 時間加熱還流した。不溶物をセライトろ過し、ろ液を濃縮した。アルゴン雰囲気下、残渣の無水テトラヒドロフラン (THF) (80 ml) 溶液に、0℃で 2 M リチウムジイソプロピルアミド (15.7 ml ; THF 溶液) を加え、室温まで昇温し、5 日間攪拌した。反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出し、水および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル) で精製して、以下の物性値を有する標題化合物 (2.85 g) を得た。

TLC : R<sub>f</sub> 0.51 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;  
 NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.10 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 6.85 (d, J = 3.0 Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 3.0, 8.4 Hz, 1H), 4.31 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 2.90 (m, 2H), 2.74 (m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.10 (m, 2H), 1.97 (s, 3H), 1.90 (s, 3H)。

実施例 19

2, 3-ジメチル-4-エチルカルボニルアミノ-1-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[e]ピロロ[2, 3-b]ピリジン



5

実施例 18 で製造した化合物 (600 mg) の THF (60 ml) 溶液に、  
 0℃ でトリエチルアミン (520 μl) およびプロピオン酸クロリド (18  
 0 μl) を加え、2 時間攪拌した。反応混合物を酢酸エチルで希釈し、希釈  
 液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫  
 10 酸マグネシウムで乾燥後、濃縮した。残渣をヘキサンで洗浄して、以下の物  
 性値を有する標題化合物 (451 mg) を得た。

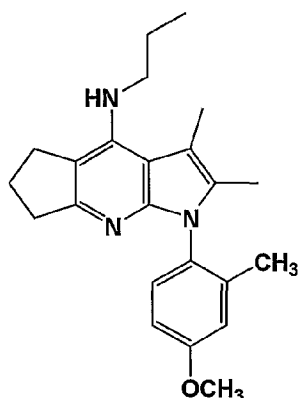
TLC : R<sub>f</sub> 0.60 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.30 (m, 1H), 7.08 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.87 (d, J =  
 2.7Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 2.98 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.87  
 15 (m, 2H), 2.51 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.09 (m, 2H), 2.02 (s, 3H), 1.88 (s, 3H), 1.33 (m,  
 3H)。

実施例 20

2, 3-ジメチル-4-プロピルアミノ-1-(2-メチル-4-メトキシ

フェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [e] ピロロ [2, 3-b] ピリジン



- 実施例 19 で製造した化合物 (451 mg) の THF (5.0 ml) 溶液に、
- 5 2M ボランジメチルスルフィド錯体 (4.8 ml : THF 溶液) を加え、5 時間加熱還流した。反応混合物にメタノールを加え、さらに 2 時間加熱還流した。反応溶液を冷却後、酢酸エチルで希釈した。希釈液を水および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) で精製して、
- 10 以下の物性値を有する標題化合物 (268 mg) を得た。

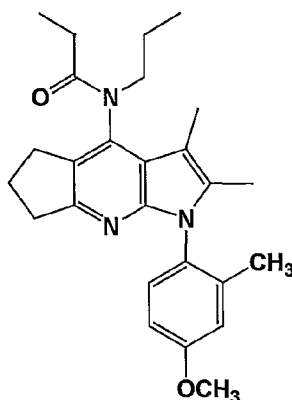
TLC : R<sub>f</sub> 0.47 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  7.09 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 6.85 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 2.7, 8.7 Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.43 (m, 2H), 3.05 (m, 2H), 2.84 (m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.04 (m, 2H), 1.97 (s, 3H), 1.90 (s, 3H), 1.65 (m, 2H), 1.02 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

15

#### 実施例 21

2, 3-ジメチル-4-(N-エチルカルボニル-N-プロピルアミノ)-1-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [e] ピロロ [2, 3-b] ピリジン



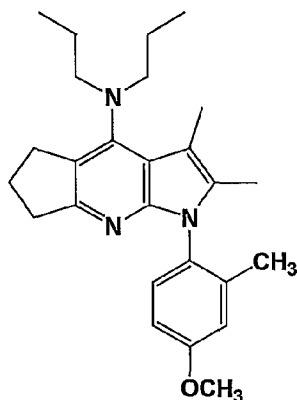
実施例 20 で製造した化合物 (234 mg) の塩化メチレン (3.0 ml) 溶液に、アルゴン雰囲気下、0℃でトリエチルアミン (360  $\mu$ l) およびプロピオン酸クロリド (134  $\mu$ l) を加え、1時間攪拌した。反応混合物を  
5 酢酸エチルで希釈し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、水および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル=2：1) で精製して、以下の物性値を有する標題化合物 (242 g) を得た。

TLC : R<sub>f</sub> 0.57 (ヘキサン：酢酸エチル=1：1) ;

10 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  7.11 (m, 1H), 6.90 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.85 (dd, J = 2.4, 8.4Hz, 1H), 3.92 (m, 1H), 3.86 (s, 3H), 3.42 (m, 1H), 3.01 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.87 (m, 2H), 2.20 (s, 3H), 1.94-2.20 (m, 4H), 2.05 (s, 3H), 1.92 and 1.90 (s, total 3H), 1.63 (m, 2H), 0.99-1.10 (m, 3H), 0.85-0.94 (m, 3H)。

## 15 実施例 22

2, 3-ジメチル-4-ジプロピルアミノ-1-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [e] ピロロ [2, 3-b] ピリジン



実施例 21 で製造した化合物 (242 mg) を用いて、実施例 20 と同様の操作を行うことによって、以下の物性値を有する標題化合物 (182 mg) を得た。

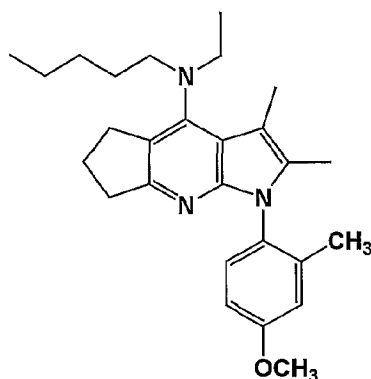
5 TLC : R<sub>f</sub> 0.45 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  7.10 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.87 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.17 (m, 4H), 2.95 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.88 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.05 (m, 2H), 2.01 (s, 3H), 1.92 (s, 3H), 1.52 (m, 4H), 0.85 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

10

#### 実施例 22 (1)

2, 3-ジメチル-4-(N-エチル-N-ペンチルアミノ)-1-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペント [e] ピロロ [2, 3-b] ピリジン



実施例 18 で製造した化合物および相当する化合物を用いて、実施例 19  
→実施例 20→実施例 21→実施例 22 と同様の操作を行うことによって、  
以下の物性値を有する標題化合物を得た。

- 5    T L C : R f   0.41 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;  
NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ   7.10 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.81  
(dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.27 (q, J = 6.9Hz, 2H), 3.18 (m, 2H), 2.95 (t, J  
= 7.2Hz, 2H), 2.88 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.05 (m, 2H), 2.00 (s, 3H), 1.91  
10   (s, 3H), 1.50 (m, 2H), 1.38-1.20 (m, 4H), 1.05 (t, J = 6.9Hz, 3H), 0.86 (t, J = 6.9Hz,  
3H)。

#### [製剤例]

##### 製剤例 1

- 以下の各成分を常法により混合した後打錠して、一錠中に 50mg の活性  
15   成分を含有する錠剤 100錠を得た。

- ・ 8 - (3 - ペンチルアミノ) - 2 - メチルー 3 - (2 - メチルー 4 - メト  
キシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ [d] ピラゾロ  
[1, 5 - a] ピリミジン ..... 5.0 g
- ・ カルボキシメチルセルロースカルシウム (崩壊剤) ..... 0.2 g
- 20   ・ ステアリン酸マグネシウム (潤滑剤) ..... 0.1 g

・微結晶セルロース …… 4.7 g

## 製剤例 2

以下の各成分を常法により混合した後、溶液を常法により滅菌し、5 ml  
5 ずつアンプルに充填し、常法により凍結乾燥し、1 アンプル中 20 mg の活性成分を含有するアンプル 100 本を得た。

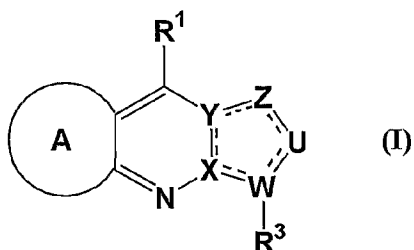
・ 8 - (3 - ペンチルアミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - メチル - 4 - メト  
キシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [d] ピラゾロ  
[1, 5 - a] ピリミジン …… 2.0 g

10 ・マンニトール …… 20 g

・蒸留水 …… 500 ml

## 請求の範囲

## 1. 一般式 (I)



- 5 (式中、  
 XおよびYはそれぞれ独立して、炭素原子または窒素原子を表わし（ただし、  
 二つは同時に窒素原子を表わさない。）、  
 Wは炭素原子または窒素原子を表わし、  
 UおよびZはそれぞれ独立して、 $CR^2$ 、 $NR^{13}$ 、窒素原子、酸素原子、硫黄  
 10 原子、 $C=O$ または $C=S$ を表わし、  
 $R^2$ は  
 (i) 水素原子、  
 (ii)  $C_1 \sim 8$  アルキル、  
 (iii)  $C_2 \sim 8$  アルケニル、  
 15 (iv)  $C_2 \sim 8$  アルキニル、  
 (v) ハロゲン原子、  
 (vi)  $CF_3$ 、  
 (vii) シアノ、  
 (viii) ニトロ、  
 20 (ix)  $NR^9R^{10}$  (基中、 $R^9$ および $R^{10}$ はそれぞれ独立して、  
 (i) 水素原子、  
 (ii)  $C_1 \sim 4$  アルキル、

- (iii) C 3 ～ 1 0 の単環もしくは二環式炭素環、
- (iv) 1 ～ 4 個の窒素原子、1 ～ 2 個の酸素原子および／または1 ～ 2 個の硫黄原子を含有する3 ～ 1 0 員の単環もしくは二環式複素環、または
- (v) C 3 ～ 1 0 の単環もしくは二環式炭素環で、もしくは1 ～ 4 個の窒素原子、1 ～ 2 個の酸素原子および／または1 ～ 2 個の硫黄原子を含有する3 ～ 1 0 員の単環もしくは二環式複素環で置換されたC 1 ～ 4 アルキルを表わす。)、
- (x) OR<sup>11</sup> (基中、R<sup>11</sup>は
- (i) 水素原子、
- (ii) C 1 ～ 4 アルキル、
- (iii) C 5 ～ 6 の炭素環、
- (iv) 1 ～ 2 個の窒素原子、1 個の酸素原子および／または1 個の硫黄原子を含有する5 または 6 員の複素環、または
- (v) C 5 ～ 6 の炭素環もしくは1 ～ 2 個の窒素原子、1 個の酸素原子および／または1 個の硫黄原子を含有する5 または 6 員の複素環で置換されたC 1 ～ 4 アルキルを表わす。)、
- (xi) SH、
- (xii) S(O)<sub>n</sub>R<sup>12</sup> (基中、n は 0、1 または 2 を表わし、R<sup>12</sup>は
- (i) C 1 ～ 4 アルキル、
- (ii) C 5 ～ 6 の炭素環、
- (iii) 1 ～ 2 個の窒素原子、1 個の酸素原子および／または1 個の硫黄原子を含有する5 または 6 員の複素環、または
- (iv) C 5 ～ 6 の炭素環もしくは1 ～ 2 個の窒素原子、1 個の酸素原子および／または1 個の硫黄原子を含有する5 または 6 員の複素環で置換されたC 1 ～ 4 アルキルを表わす。)、
- (xiii) COR<sup>11</sup>、

- (xiv)  $\text{COOR}^{11}$ 、
- (xv)  $\text{CONR}^9\text{R}^{10}$ 、
- (xvi)  $\text{C}_{3\sim 10}$ の単環もしくは二環式炭素環、
- (xvii) 1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する  $\text{C}_{3\sim 10}$ 員の単環もしくは二環式複素環、または
- 5 (xviii) ハロゲン原子、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{OCF}_3$ 、シアノ、ニトロ、 $\text{NR}^9\text{R}^{10}$ 、 $\text{OR}^{11}$ 、 $=\text{N}-\text{OR}^{11}$ 、 $\text{SH}$ 、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^{12}$ 、 $\text{COR}^{11}$ 、 $\text{COOR}^{11}$ 、 $\text{CONR}^9\text{R}^{10}$ 、 $\text{C}_{3\sim 10}$ の単環もしくは二環式炭素環、および1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する  $\text{C}_{3\sim 10}$ 員の単環もしくは二環式複素環から選ばれる基 1～2個で置換されている  $\text{C}_{1\sim 4}$ アルキルを表わし、
- 10  $\text{R}^{13}$ は
- (i) 水素原子、
- (ii)  $\text{C}_{1\sim 4}$ アルキル、
- 15 (iii)  $\text{C}_{2\sim 4}$ アルケニル、
- (iv)  $\text{C}_{2\sim 4}$ アルキニル、
- (v)  $\text{C}_{3\sim 10}$ の単環もしくは二環式炭素環、
- (vi) 1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する  $\text{C}_{3\sim 10}$ 員の単環もしくは二環式複素環、または
- 20 (vii)  $\text{C}_{3\sim 10}$ の単環もしくは二環式炭素環で、または1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する  $\text{C}_{3\sim 10}$ 員の単環もしくは二環式複素環で置換されている  $\text{C}_{1\sim 4}$ アルキルを表わし、
- ≡ は単結合または二重結合を表わし、



- 25 は  $\text{C}_{1\sim 4}$ アルキル、 $\text{C}_{1\sim 4}$ アルコキシ、ハロゲン原子および  $\text{CF}_3$  から選

ばれる基 1 ～ 3 個で置換されているか、もしくは無置換の C 4 ～ 6 炭素環、または窒素原子、酸素原子または硫黄原子を少なくとも 1 個含有する 4 ～ 6 員の複素環を表わし、

$R^1$  は

- 5 (i) 1 ～ 5 個の  $R^{14}$  で置換されているかもしくは無置換の C 1 ～ 8 アルキル、
- (ii) 1 ～ 5 個の  $R^{14}$  で置換されているかもしくは無置換の C 2 ～ 8 アルケニル、
- (iii) 1 ～ 5 個の  $R^{14}$  で置換されているかもしくは無置換の C 2 ～ 8 アルキニル、
- 10 (iv)  $NR^4R^5$  (基中、 $R^4$  および  $R^5$  はそれぞれ独立して、
  - (i) 水素原子、
  - (ii) 1 ～ 5 個の  $R^{17}$  で置換されているかもしくは無置換の C 1 ～ 15 アルキル、
  - (iii) 1 ～ 5 個の  $R^{17}$  で置換されているかもしくは無置換の C 2 ～ 15
  - 15 アルケニル、
  - (iv) 1 ～ 5 個の  $R^{17}$  で置換されているかもしくは無置換の C 2 ～ 15 アルキニル、
  - (v) 1 ～ 5 個の  $R^{18}$  で置換されているかもしくは無置換の C 3 ～ 15 の単環もしくは二環式炭素環、
  - 20 (vi) 1 ～ 5 個の  $R^{18}$  で置換されているかもしくは無置換の 1 ～ 4 個の窒素原子、1 ～ 2 個の酸素原子および／または 1 ～ 2 個の硫黄原子を含有する 3 ～ 15 員の単環もしくは二環式複素環を表わす。 ) 、
- (v)  $OR^6$  (基中、 $R^6$  は
  - (i) 水素原子、
  - 25 (ii) C 1 ～ 10 アルキル、
  - (iii) C 2 ～ 10 アルケニル、

- (iv) C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルキニル、
- (v) 1～5個のR<sup>18</sup>で置換されているかもしくは無置換のC<sub>3</sub>～C<sub>15</sub>の単環もしくは二環式炭素環、
- (vi) 1～5個のR<sup>18</sup>で置換されているかもしくは無置換の1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する3～15員の単環もしくは二環式複素環、または
- (vii) ハロゲン原子、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、シアノ、ニトロ、NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>、OR<sup>11</sup>、=N-OR<sup>11</sup>、SH、S(O)<sub>n</sub>R<sup>12</sup>、COR<sup>11</sup>、COOR<sup>11</sup>、CONR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>、1～5個のR<sup>18</sup>で置換されているかもしくは無置換のC<sub>3</sub>～C<sub>10</sub>の単環もしくは二環式炭素環、および1～5個のR<sup>18</sup>で置換されているかもしくは無置換の1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する3～10員の単環もしくは二環式複素環から選ばれる基1～2個で置換されているC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルを表わす。)、
- (vi) SH、
- (vii) S(O)<sub>n</sub>R<sup>7</sup> (基中、nは前記と同じ意味を表わし、R<sup>7</sup>は
- (i) C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、
- (ii) 1～5個のR<sup>18</sup>で置換されているかもしくは無置換のC<sub>3</sub>～C<sub>10</sub>の単環もしくは二環式炭素環、
- (iii) 1～5個のR<sup>18</sup>で置換されているかもしくは無置換の1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する3～10員の単環もしくは二環式複素環、または
- (iv) 1～5個のR<sup>18</sup>で置換されているかもしくは無置換のC<sub>3</sub>～C<sub>10</sub>の単環もしくは二環式炭素環で、または1～5個のR<sup>18</sup>で置換されているかもしくは無置換の1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する3～10員の単環もしくは二

環式複素環で置換されたC 1～4アルキルを表わす。)、

(viii) COR<sup>6</sup>、

(ix) COOR<sup>6</sup>、

(x) CONR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、

5 (xi) NR<sup>8</sup>COR<sup>6a</sup> (基中、R<sup>6a</sup>は

(i) 水素原子、

(ii) C 1～10アルキル、

(iii) C 2～10アルケニル、

(iv) C 2～10アルキニル、

10 (v) ハロゲン原子、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、シアノ、ニトロ、NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>、OR<sup>11a</sup>、=N-OR<sup>11</sup>、SH、S(O)<sub>n</sub>R<sup>12</sup>、COR<sup>11</sup>、COOR<sup>11</sup>、およびCONR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>から選ばれる基1～2個で置換されているC 1～4アルキルを表わす。)、

(xii) NR<sup>8</sup>COOR<sup>6</sup> (基中、R<sup>6</sup>は前記と同じ意味を表わし、R<sup>8</sup>は

15 (i) 水素原子、

(ii) C 1～8アルキル、

(iii) C 2～8アルケニル、

(iv) C 2～8アルキニル、

20 (v) 1～5個のR<sup>18</sup>で置換されているかもしくは無置換のC 3～10の単環もしくは二環式炭素環、

(vi) 1～5個のR<sup>18</sup>で置換されているかもしくは無置換の1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および/または1～2個の硫黄原子を含有する3～10員の単環もしくは二環式複素環、または

25 (vii) ハロゲン原子、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、シアノ、ニトロ、NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>、OR<sup>11</sup>、=N-OR<sup>11</sup>、SH、S(O)<sub>n</sub>R<sup>12</sup>、COR<sup>11</sup>、COOR<sup>11</sup>、CONR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>、1～5個のR<sup>18</sup>で置換されているかもしくは無置換の

C 3 ~ 1 0 の単環もしくは二環式炭素環、および 1 ~ 5 個の  $R^{18}$  で置換されているかもしくは無置換の 1 ~ 4 個の窒素原子、1 ~ 2 個の酸素原子および／または 1 ~ 2 個の硫黄原子を含有する 3 ~ 1 0 員の単環もしくは二環式複素環から選ばれる基 1 ~ 2 個で置換されている C 1 ~ 4 アルキルを表わす。)、

(xiii)  $NR^8CONR^4R^5$ 、

(xiv) 1 ~ 5 個の  $R^{15}$  で置換されているかもしくは無置換の C 3 ~ 1 5 の単環もしくは二環式炭素環、または

(xv) 1 ~ 5 個の  $R^{15}$  で置換されているかもしくは無置換の 1 ~ 4 個の窒素原子、1 ~ 2 個の酸素原子および／または 1 ~ 2 個の硫黄原子を含有する 3 ~ 1 5 員の単環もしくは二環式複素環を表わし、

$R^{11a}$  は (i) 水素原子、(ii) C 1 ~ 4 アルキル、または (iii) C 5 ~ 6 の炭素環または 1 ~ 2 個の窒素原子、1 個の酸素原子および／または 1 個の硫黄原子を含有する 5 または 6 員の複素環で置換された C 1 ~ 4 アルキルを表わし、

$R^{14}$  は (a) ハロゲン原子、(b)  $CF_3$ 、(c)  $OCF_3$ 、(d) シアノ、(e) ニトロ、(f)  $NR^4R^5$ 、(g)  $OR^6$ 、(h)  $=N-OR^6$ 、(j) SH、(k)  $S(O)_nR^7$ 、(l)  $COR^6$ 、(m)  $COOR^6$ 、(n)  $CONR^4R^5$ 、(o)  $NR^8COR^6$ 、(p)  $NR^8COOR^6$ 、(q)  $NR^8CONR^4R^5$ 、(r) 1 ~ 5 個の  $R^{15}$  で置換されているかもしくは無置換の C 3 ~ 1 5 の単環もしくは二環式炭素環、または (s) 1 ~ 5 個の  $R^{15}$  で置換されているかもしくは無置換の 1 ~ 4 個の窒素原子、1 ~ 2 個の酸素原子および／または 1 ~ 2 個の硫黄原子を含有する 3 ~ 1 5 員の単環もしくは二環式複素環を表わし、

$R^{15}$  は (a) C 1 ~ 8 アルキル、(b) C 2 ~ 8 アルケニル、(c) C 2 ~ 8 アルキニル、(d) C 1 ~ 4 アルコキシ (C 1 ~ 4) アルキル、(e) ハロゲン原子、(f)  $CF_3$ 、(g)  $OCF_3$ 、(h) シアノ、(j) ニトロ、(k)  $NR^4R^5$ 、(l)  $OR^6$ 、(m) SH、(n)  $S(O)_nR^7$ 、(o)  $COR^6$ 、(p)  $COOR^6$ 、(q)  $CONR^4R^5$ 、(r)

NR<sup>8</sup>COR<sup>6</sup>、(s)NR<sup>8</sup>COOR<sup>6</sup>、(t)NR<sup>8</sup>CONR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、(u)1～5個のR<sup>20</sup>で置換されているかもしくは無置換のC3～10の単環もしくは二環式炭素環、(v)1～5個のR<sup>20</sup>で置換されているかもしくは無置換の1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する3～10員の単環もしくは二環式複素環、(w)ハロゲン原子、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、シアノ、ニトロ、NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、OR<sup>6</sup>、=N—OR<sup>6</sup>、SH、S(O)<sub>n</sub>R<sup>7</sup>、COR<sup>6</sup>、COOR<sup>6</sup>、CONR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、NR<sup>8</sup>COR<sup>6</sup>、NR<sup>8</sup>COOR<sup>6</sup>、NR<sup>8</sup>CONR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、1～5個のR<sup>20</sup>で置換されているかもしくは無置換のC3～10の単環もしくは二環式炭素環、および1～5個のR<sup>20</sup>で置換されているかもしくは無置換の1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する3～10員の単環もしくは二環式複素環から選ばれる基1～2個で置換されているC1～4アルキルを表わし、

R<sup>17</sup>は(a)ハロゲン原子、(b)CF<sub>3</sub>、(c)OCF<sub>3</sub>、(d)シアノ、(e)ニトロ、(f)NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>、(g)OR<sup>11a</sup>、(h)=N—OR<sup>11</sup>、(j)SH、(k)S(O)<sub>n</sub>R<sup>12</sup>、(l)COR<sup>11</sup>、(m)COOR<sup>11</sup>、(n)CONR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>、(o)NR<sup>8</sup>COR<sup>11</sup>、(p)NR<sup>8</sup>COOR<sup>11</sup>、(q)NR<sup>8</sup>CONR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>、(r)1～5個のR<sup>18a</sup>で置換されているかもしくは無置換のC3～15の単環もしくは二環式炭素環、または(s)1～5個のR<sup>18a</sup>で置換されているかもしくは無置換の1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する3～15員の単環もしくは二環式複素環を表わし、

R<sup>18</sup>は(a)C1～4アルキル、(b)C2～4アルケニル、(c)C2～4アルキニル、(d)ハロゲン原子、(e)CF<sub>3</sub>、(f)OCF<sub>3</sub>、(g)シアノ、(h)ニトロ、(j)SH、(k)S(O)<sub>n</sub>R<sup>12</sup>、(l)NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>、(m)OR<sup>11</sup>、(n)COR<sup>11</sup>、(o)COOR<sup>11</sup>、(p)CONR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>、(q)C5～6の炭素環、(r)1～2個の窒素原子、1個の酸素原子および／または1個の硫黄原子を含有する5または6員の複素環、または(s)C5～6の炭素環または1～2個の窒素原子、1個の酸素原

子および／または1個の硫黄原子を含有する5または6員の複素環で置換されたC 1～4アルキルで置換されたC 1～4アルキル表わし、

- $R^{18a}$ は(a) C 1～4アルキル、(b) C 2～4アルケニル、(c) C 2～4アルキニル、(d) ハロゲン原子、(e)  $CF_3$ 、(f)  $OCF_3$ 、(g) シアノ、(h) ニトロ、
- 5 (j) SH、(k)  $S(O)_n R^{12}$ 、(l)  $NR^9 R^{10}$ 、(m)  $OR^{11a}$ 、(n)  $COR^{11}$ 、(o)  $COOR^{11}$ 、または(p)  $CONR^9 R^{10}$ を表わし、

$R^{19}$ はC 1～4アルキル、C 1～4アルコキシ、ハロゲン原子、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、シアノ、ニトロ、アミノ、 $NH$  (C 1～4アルキル)、または $N$  (C 1～4アルキル)<sub>2</sub>を表わし、

- 10  $R^3$ は(i) 1～5個の $R^{16}$ によって置換されているC 5～10の単環もしくは二環式炭素環、または
- (ii) 1～5個の $R^{16}$ によって置換されている1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する5～10員の単環もしくは二環式複素環を表わし、

- 15  $R^{16}$ は、

(a) C 1～8アルキル、

(b) C 2～8アルケニル、

(c) C 2～8アルキニル、

(d) ハロゲン原子、

- 20 (e)  $CF_3$ 、
- (f)  $OCF_3$ 、
- (g) シアノ、
- (h) ニトロ、
- (j)  $NR^9 R^{10}$ 、
- 25 (k)  $OR^{11}$ 、
- (l) SH、

- (m)  $S(O)_n R^{12}$  (ただし、フェニルチオは除く。)、  
 (n)  $COR^{11}$ 、  
 (o)  $COOR^{11}$ 、  
 (p)  $CONR^9 R^{10}$ 、  
 5 (q)  $NR^8 COR^{11}$ 、  
 (r)  $NR^8 COOR^{11}$ 、  
 (s)  $NR^8 CONR^9 R^{10}$ 、  
 (t) C 3～10の単環もしくは二環式炭素環、  
 (u) 1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄  
 10 原子を含有する3～10員の単環もしくは二環式複素環、または  
 (v) ハロゲン原子、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、シアノ、ニトロ、 $NR^9 R^{10}$ 、 $OR^{11}$ 、  
 $=N-OR^{11}$ 、SH、 $S(O)_n R^{12}$ 、 $COR^{11}$ 、 $COOR^{11}$ 、 $CONR^9 R^{10}$ 、  
 $NR^8 COR^{11}$ 、 $NR^8 COOR^{11}$ 、 $NR^8 CONR^9 R^{10}$ 、C 3～10の  
 単環もしくは二環式炭素環、および1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原  
 15 子および／または1～2個の硫黄原子を含有する3～10員の単環もしくは  
 二環式複素環から選ばれる基1～2個で置換されているC 1～4アルキルを  
 表わす。
- ただし、(1) XおよびWが炭素原子、YおよびZが窒素原子、Uが $CR^4$ 、  
 かつ $R^1$ が $OR^6$ を表わすとき、 $R^3$ は1個のハロゲンで置換されたフェニル、  
 20 1個のトリフルオロメチルで置換されたフェニル、トリフルオロメチルおよ  
 びニトロで置換されたフェニルは表わさず、(2) X、YおよびZが炭素原  
 子であり、UおよびWが窒素原子の時、 $R^3$ は1～5個の $R^{16}$ によって置換さ  
 れているC 5～10の単環もしくは二環式炭素環である。)
- で示される化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

25

2. Xが炭素原子、Yが窒素原子であり、UおよびZが炭素原子または窒

素原子、およびWが炭素原子である請求の範囲1に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

3. X、UおよびWが炭素原子、YおよびZが窒素原子である請求の範囲  
5 2に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

4. X、Z、UおよびWが炭素原子、Yが窒素原子である請求の範囲2に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

- 10 5. X、Y、ZおよびUが炭素原子、Wが窒素原子である請求の範囲1に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

6. 一般式(I)中、式



- 15 で示される環がC 4～6 炭素環である請求の範囲1に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

7. 一般式(I)中、式



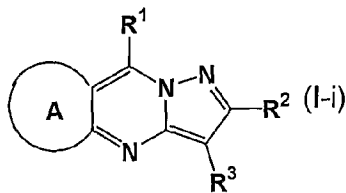
- 20 で示される環が窒素原子、酸素原子または硫黄原子を少なくとも1個含有する4～6員の複素環である請求の範囲1に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

8.  $R^1$ が

- (i) 1～5個の $R^{14}$ で置換されているかもしくは無置換のC 1～8アルキル、  
(ii) 1～5個の $R^{14}$ で置換されているかもしくは無置換のC 2～8アルケニ  
ル、  
(iii) 1～5個の $R^{14}$ で置換されているかもしくは無置換のC 2～8アルキニ  
5 ル、  
(iv)  $NR^4R^5$ 、  
(v)  $OR^6$ 、  
(vi) 1～5個の $R^{15}$ で置換されているかもしくは無置換のC 3～15の単環  
もしくは二環式炭素環、または  
10 (vii) 1～5個の $R^{15}$ で置換されているかもしくは無置換の1～4個の窒素原  
子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する3～  
15 員単環もしくは二環式複素環（基中、 $R^{14}$ および $R^{15}$ は請求の範囲1  
と同じ意味を表わす。）である請求の範囲1に記載の化合物、その薬学的に  
許容される塩またはそれらの水和物。

15

9. 一般式 (I) で示される化合物が式 (I-i)



- （式中、すべての記号は請求の範囲1と同じ意味を表わす。）で示される化  
合物である請求の範囲1に記載の化合物、その薬学的に許容される塩または  
20 それらの水和物。

10. 一般式 (I-i) 中、式



で示される環がC 4～6 炭素環である請求の範囲 9 に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

5 1 1. 一般式 (I - i) 中、式



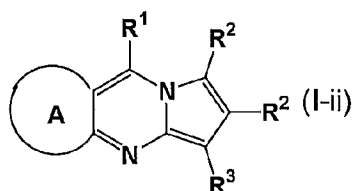
で示される環が窒素原子、酸素原子または硫黄原子を少なくとも 1 個含有する 4～6 員の複素環である請求の範囲 9 に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

10

- 1 2.  $R^1$ が $NR^4R^5$ であり、かつ(a)  $R^4$ が(i) 水素原子であり、 $R^5$ が(ii) 1～5 個の $R^{17}$ で置換されているかもしくは無置換のC 1～1 5 アルキル、(iii) 1～5 個の $R^{17}$ で置換されているかもしくは無置換のC 2～1 5 アルケニル、(iv) 1～5 個の $R^{17}$ で置換されているかもしくは無置換のC 2～1 5
- 15 アルキニル、(v) 1～5 個の $R^{18}$ で置換されているかもしくは無置換のC 3～1 5 の単環もしくは二環式炭素環、または(vi) 1～5 個の $R^{18}$ で置換されているかもしくは無置換の 1～4 個の窒素原子、1～2 個の酸素原子および/または 1～2 個の硫黄原子を含有する 3～1 5 員の単環もしくは二環式複素環であるか、または
- 20 (b)  $R^4$ が(ii) 1～5 個の $R^{17}$ で置換されているかもしくは無置換のC 1～1 5 アルキル、(iii) 1～5 個の $R^{17}$ で置換されているかもしくは無置換のC 2～1 5 アルケニル、(iv) 1～5 個の $R^{17}$ で置換されているかもしくは無置換のC 2～1 5 アルキニル、または(v-1) C 3～6 の単環の飽和炭素環であり、

- $R^5$ が(ii) 1～5個の $R^{17}$ で置換されているかもしくは無置換のC 1～1 5  
 アルキル、(iii) 1～5個の $R^{17}$ で置換されているかもしくは無置換のC 2～  
 1 5アルケニル、(iv) 1～5個の $R^{17}$ で置換されているかもしくは無置換の  
 C 2～1 5アルキニル、(v) 1～5個の $R^{18}$ で置換されているかもしくは無置  
 5 換のC 3～1 5の単環もしくは二環式炭素環、(vi) 1～5個の $R^{18}$ で置換さ  
 れているかもしくは無置換の1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子およ  
 び／または1～2個の硫黄原子を含有する3～1 5員の単環もしくは二環式  
 複素環（基中、 $R^{17}$ および $R^{18}$ は請求の範囲1と同じ意味を表わす。）であ  
 る請求の範囲9に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの  
 10 水和物。

1 3. 一般式 (I) で示される化合物が式 (I -ii)



- （式中、すべての記号は請求の範囲1と同じ意味を表わす。）で示される化  
 15 合物である請求の範囲1に記載の化合物、その薬学的に許容される塩または  
 それらの水和物。

1 4. 一般式 (I -ii) 中、式



- 20 で示される環がC 4～6炭素環である請求の範囲1 3に記載の化合物、その  
 薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

1 5. 一般式 (I - ii) 中、式



で示される環が窒素原子、酸素原子または硫黄原子を少なくとも1個含有する4～6員の複素環である請求の範囲13に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

- 1 6.  $R^1$ が $NR^4R^5$ であり、かつ(a)  $R^4$ が(i)水素原子であり、 $R^5$ が(ii) 1～5個の $R^{17}$ で置換されているかもしくは無置換のC1～15アルキル、
- 10 (iii) 1～5個の $R^{17}$ で置換されているかもしくは無置換のC2～15アルケニル、(iv) 1～5個の $R^{17}$ で置換されているかもしくは無置換のC2～15アルキニル、(v) 1～5個の $R^{18}$ で置換されているかもしくは無置換のC3～15の単環もしくは二環式炭素環、または(vi) 1～5個の $R^{18}$ で置換されているかもしくは無置換の1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／
- 15 または1～2個の硫黄原子を含有する3～15員の単環もしくは二環式複素環であるか、または
- (b)  $R^4$ が(ii) 1～5個の $R^{17}$ で置換されているかもしくは無置換のC1～15アルキル、(iii) 1～5個の $R^{17}$ で置換されているかもしくは無置換のC2～15アルケニル、(iv) 1～5個の $R^{17}$ で置換されているかもしくは無置換
- 20 のC2～15アルキニル、または(v-1) C3～6の単環の飽和炭素環であり、 $R^5$ が(ii) 1～5個の $R^{17}$ で置換されているかもしくは無置換のC1～15アルキル、(iii) 1～5個の $R^{17}$ で置換されているかもしくは無置換のC2～15アルケニル、(iv) 1～5個の $R^{17}$ で置換されているかもしくは無置換のC2～15アルキニル、(v) 1～5個の $R^{18}$ で置換されているかもしくは無置換
- 25 換のC3～15の単環もしくは二環式炭素環、(vi) 1～5個の $R^{18}$ で置換さ

れているかもしくは無置換の1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する3～15員の単環もしくは二環式複素環である請求の範囲13に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

5

17. 化合物が、

- (1) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 10 (2) 8-(N-エチル-N-n-ブチルアミノ)-2-メトキシメチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (3) 8-(N-プロピル-N-(2-ヒドロキシエチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5
- 15 H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (4) 9-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,6,7,8-テトラヒドロピラゾロ[3,2-b]キナゾリン、
- (5) 8-[(2S)-1,1-ジメトキシブタン-2-イル]アミノ-2
- 20 -メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (6) 8-(1,3-ジメトキシプロパン-2-イル)アミノ-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 25 (7) 8-ビス(2-メトキシエチル)アミノ-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]

- ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (8) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 5 (9) 8-ジエチルアミノ-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (10) 8-(N-エチル-N-n-ブチルアミノ)-2-メチル-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 10 (11) 8-ジシクロプロピルメチルアミノ-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (12) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メトキシメチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 15 (13) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(1, 3-ジオキサインダン-5-イル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (14) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(3, 4-ジメトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 20 (15) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-シクロブチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 25 (16) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-エチル-3-(2-メチル-4-メ

- トキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ  
[1, 5-a] ピリミジン、
- (17) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-イソプロピル-3-(2-メチル-  
4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピ  
5 ラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (18) 8-(2-エチルブチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4  
-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラ  
ゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (19) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチルチオメチル-3-(2-メチ  
10 ル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d]  
ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (20) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2, 4-ジメチルフ  
ェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5  
-a] ピリミジン、
- 15 (21) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2, 5-ジメチルフ  
ェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5  
-a] ピリミジン、
- (22) 8-シクロブチルアミノ-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキ  
シフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1,  
20 5-a] ピリミジン、
- (23) 8-(N-エチル-N-シクロブチルアミノ)-2-メチル-3-(2  
-メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペン  
タ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (24) 8-(プロパン-1, 3-ジオール-2-イル) アミノ-2-メチル-  
25 3-(2-メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シ  
クロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、

- (25) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-(2-フリル)-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (26) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-フェニル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 5 (27) 8-(2-ジメチルアミノエチル)アミノ-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 10 (28) 8-(N-メチル-N-(2-ジメチルアミノエチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (29) 8-(N-エチル-N-(2-ジメチルアミノエチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 15 (30) 8-(4-ヘプチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (31) 8-(2-ブチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 20 (32) 8-(N-プロピル-N-シクロプロピルメチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 25 (33) 8-(3-ペンチルアミノ)-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]

ピリミジン、

(34) 8-[(2R)-1-メトキシブタン-2-イル]アミノ-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、

5 (35) 8-[(2S)-1-メトキシブタン-2-イル]アミノ-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、

(36) 8-シクロペンチルアミノ-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、

(37) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2,4-ジフルオロフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、

(38) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-トリフルオロメチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、

(39) 8-(N-エチル-N-(2-メトキシエチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、

20 (40) 8-シクロヘキシルアミノ-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、

(41) 8-(N-プロピル-N-(3-ペンチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、

(42) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、

- ル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a]  
ピリミジン、
- (43) 8 - (3-ペンチルアミノ) - 2-イソプロピル-3 - (4-メトキシ  
フェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1,  
5 5-a] ピリミジン、
- (44) 8 - t-ブチルアミノ-2-メチル-3 - (2-メチル-4-メトキシ  
フェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1,  
5-a] ピリミジン、
- (45) 8 - (3-ペンチルアミノ) - 3 - (2, 4, 6-トリメチルフェニル)  
10 - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピ  
リミジン、
- (46) 8 - (1-シクロブチルエチル) アミノ-2-メチル-3 - (2-メチ  
ル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d]  
ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (47) 8 - (3-ペンチルアミノ) - 2-メチル-3 - (2, 3-ジメチル-  
15 4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピ  
ラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (48) 8 - (3-ペンチルアミノ) - 2-メチル-3 - (2, 5-ジメチル-  
4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピ  
20 ラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (49) 8 - (N - (2, 2, 2-トリフルオロエチル) - N-シクロプロピル  
メチルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-メチル-4-メトキシフェニル)  
- 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピ  
リミジン、
- (50) 8 - (2, 2, 2-トリフルオロエチル) アミノ-2-メチル-3 - (2  
25 -メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペン

- タ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (51) 8-(3-ペンチルアミノ)-3-(2, 6-ジメチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 5 (52) 8-(3-ペンチルアミノ)-3-(4, 6-ジメチル-2-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (53) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2, 6-ジメチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 10 (54) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2, 6-ジメチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (55) 8-(3-メチルペンタン-3-イル) アミノ-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 15 (56) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(5-クロロ-1, 3-ジオキサインダン-6-イル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 20 (57) 8-(N-エチル-N-ベンジルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (58) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 25 (59) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メ

- トキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ  
[1, 5-a] ピリミジン、
- (60) 8-(N-ベンジル-N-(2-メトキシエチル) アミノ)-2-メチ  
ル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H  
5 -シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (61) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メトキシ-4,  
5-ジメチルフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピ  
ラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (62) 8-フェニルアミノ-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフ  
10 エニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5  
-a] ピリミジン、
- (63) 8-(2-メチルフェニル) アミノ-2-メチル-3-(2-メチル-  
4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピ  
ラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 15 (64) 8-(3-メチルフェニル) アミノ-2-メチル-3-(2-メチル-  
4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピ  
ラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (65) 8-(4-メチルフェニル) アミノ-2-メチル-3-(2-メチル-  
4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピ  
20 ラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (66) 8-(N-フェニル-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-  
メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ  
[d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (67) 8-(N-ベンジル-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-  
25 メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ  
[d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、

- (68) 8-(N, N-ジアリルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、
- (69) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-ジメチルアミノフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、
- (70) 8-(1-フェニルプロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、
- 10 (71) 8-(N-(2-フェニルエチル)-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、
- (72) 8-(N-(3-フェニルプロピル)-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、
- 15 (73) 8-(N-(4-フェニルブチル)-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、
- (74) 8-(1-フェニル-2-ブチル)アミノ-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、
- 20 (75) 8-(1-フェニル-3-ペンチル)アミノ-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、
- 25 (76) 8-(N-(4-メチルフェニル)-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H

- ーシクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (77) 8- (N- (4-メチルフェニル) メチル-N-プロピルアミノ) -2-  
 -メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒドロ  
 -5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 5 (78) 8- (N- (3-メチルフェニル) -N-プロピルアミノ) -2-メチ  
 ル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5H  
 -シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (79) 8- (N- (4-メトキシフェニル) メチル-N-プロピルアミノ) -  
 2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒド  
 10 ロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (80) 8- (N- (4-クロロフェニル) メチル-N-プロピルアミノ) -2-  
 -メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒドロ  
 -5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (81) 8- (N- (2-メチルフェニル) -N-プロピルアミノ) -2-メチ  
 15 ル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5H  
 -シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (82) 8- (3-ペンチルアミノ) -2-メチル-3- (2-ジメチルアミノ  
 -4-メチルピリジン-5-イル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペン  
 タ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 20 (83) 8- ( (2S) -1-メトキシ-3-フェニル-2-プロピル) アミノ  
 -2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒ  
 ドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (84) 8- (N- (4-メチルチオフェニル) メチル-N-プロピルアミノ)  
 -2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒ  
 25 ドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (85) 8- (N, N-ジブチルアミノ) -2-メチル-3- (2-メチル-4

- ーメトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラ  
 ズロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (86) 8 - (N-メチル-N-ブチルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-メチ  
 ル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d]
- 5 ピラズロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (87) 8 - (N - (4-メチルフェニル) メチル-N-ブチルアミノ) - 2-  
 メチル-3 - (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-  
 5H-シクロペンタ [d] ピラズロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (88) 8 - (N - (4-メチルフェニル) メチル-N - (2-メトキシエチル)
- 10 アミノ) - 2-メチル-3 - (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 6,  
 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラズロ [1, 5-a] ピリミジ  
 ン、
- (89) 8 - (N-シクロプロピル-N - (4-メチルフェニル) メチルアミノ)  
 - 2-メチル-3 - (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒ
- 15 ドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラズロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (90) 8 - (N-シクロプロピルメチル-N - (4-メチルフェニル) メチル  
 アミノ) - 2-メチル-3 - (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 6,  
 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラズロ [1, 5-a] ピリミジ  
 ン、
- 20 (91) 8 - (N, N-ジプロピルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-メチル-  
 4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピ  
 ラズロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (92) 8 - (N - (4-メチルフェニル) メチル-N - (2-ブチニル) アミ  
 ノ) - 2-メチル-3 - (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-
- 25 ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラズロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (93) 8 - (N-プロピル-N - (2-ブチニル) アミノ) - 2-メチル-3

- (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (94) 8- (5-ノニルアミノ) - 2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (95) 8- (N-シクロペンチル-N- (4-メチルフェニル) メチルアミノ) - 2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (96) 8- (N-シクロプロピルメチル-N- (4-メチルチオフェニル) メチルアミノ) - 2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (97) 8- (N- (4-フルオロフェニル) メチル-N-プロピルアミノ) - 2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (98) 8- (N-シクロブチル-N- (4-メチルフェニル) メチルアミノ) - 2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (99) 8- (N-エチル-N- (4-メチルフェニル) メチルアミノ) - 2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (100) 8- (N-プロピル-N- (4-トリフルオロメチルフェニル) メチルアミノ) - 2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (101) 8- (N-プロピル-N- (テトラヒドロフラン-2-イル) メチル

アミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - メチル - 4 - メトキシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン、

(102) 8 - (N - プチル - N - (2 - メトキシエチル) アミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - メチル - 4 - メトキシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン、

(103) 8 - (N - プロピル - N - シクロプロピルアミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - メチル - 4 - メトキシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン、

10 (104) 8 - (N - シクロブチルメチル - N - (2 - メトキシエチル) アミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - メチル - 4 - メトキシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン、

(105) 8 - (4 - ヘプチルアミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - クロロ - 4 - メトキシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ [d] ピラゾ  
15 ロ [1, 5 - a] ピリミジン、

(106) 8 - (N - シクロプロピルメチル - N - (2 - プチリル) アミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - メチル - 4 - メトキシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン、

(107) 8 - (N - (2 - メトキシエチル) - N - (2 - プチリル) アミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - メチル - 4 - メトキシフェニル) - 6, 7 - ジヒ  
20 ドロ - 5H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン、

(108) 8 - (2 - プチリルアミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - メチル - 4 - メトキシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ [d] ピラゾ  
ロ [1, 5 - a] ピリミジン、

25 (109) 8 - (N - シクロプロピルメチル - N - (4 - メチルフェニル) メチルアミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - メチル - 4 - メトキシフェニル) - 6,

- 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (110) 8-(N-プロピル-N-(4-トリフルオロメチルオキシフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (111) 8-(N-(2-ブチル)-N-シクロプロピルメチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 10 (112) 8-(N-プロピル-N-(3-メチルフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (113) 8-(N-プロピル-N-(2-メチルフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 15 (114) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-エトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (115) 8-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 20 (116) 8-(N-メチル-N-(3-ペンチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 25 (117) 8-(N-メチル-N-(4-ヘプチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シク

- ロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (118) 8-(N-シクロブチル-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 5 (119) 8-(N-イソブチル-N-(2-ジメチルアミノエチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、2
- (120) 8-(N-プロピル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒ
- 10 ドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (121) 8-(N-シクロプロピルメチル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 15 (122) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、2
- (123) 8-(N-ブチル-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ
- 20 [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (124) 8-(N-シクロプロピル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (125) 8-(N-プロピル-N-(2-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒ
- 25 ドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、

- (126) 8-(N-プロピル-N-(3-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (127) 8-ジシクロプロピルメチルアミノ-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (128) 8-(N-ブチル-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 10 (129) 8-(N-シクロプロピルメチル-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (130) 8-(N-(2-ブチニル)-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 15 (131) 8-(N-ブチル-N-(2-メトキシエチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (132) 8-(N-シクロプロピルメチル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 20 (133) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(3,5-ジクロロピリジン-2-イル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 25 (134) 8-(N-ブチル-N-エチルアミノ)-2-メチル-3-(2-ク

- ロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]  
 ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (135) 8-(N-シクロプロピルメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (136) 8-(N-ベンジル-N-(2-ジメチルアミノエチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、2
- 10 (137) 8-(N-ベンジル-N-(2-ジメチルアミノエチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、2
- (138) 8-(N-(2-ブチル)-N-エチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 15 (139) 8-(N-(2-ブチル)-N-エチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (140) 8-(N,N-ジプロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 20 (141) 8-(N-プロピル-N-(4-シアノフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 25 (142) 8-(N-プロピル-N-(3-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒ

- ドロー5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、
- (143) 8-ジプロピルアミノ-2-メチル-3-(2, 5-ジクロロフェニル)-6, 7-ジヒドロー5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、
- 5 (144) 8-ジプロピルアミノ-2-メチル-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-6, 7-ジヒドロー5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、
- (145) 8-ジプロピルアミノ-2-メチル-3-(4-メチルフェニル)-6, 7-ジヒドロー5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、
- 10 (146) 8-ジプロピルアミノ-2-メチル-3-(3-メチルフェニル)-6, 7-ジヒドロー5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、
- (147) 8-ジプロピルアミノ-2-メチル-3-(2-メチルフェニル)-6, 7-ジヒドロー5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、
- 15 (148) 8-(N-プロピル-N-(ベンゾ[d]1, 3-ジオキサラン-5-イル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロー5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、
- 20 (149) 8-(N-プロピル-N-(ベンゾ[d]1, 3-ジオキサラン-5-イル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロー5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、
- 25 (150) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチルフェニル)-6, 7-ジヒドロー5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]

ピリミジン、

(151) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(3-メチルフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、

5 (152) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(4-メチルフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、

(153) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチルチオ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、

(154) 8-(N-ベンジル-N-シクロプロピルメチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、

15 (155) 8-(N-ベンジル-N-シクロプロピルメチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、

(156) 8-(N-ブチル-N-(2-ブチニル)アミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、

20 (157) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-フルオロフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、

(158) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2,5-ジクロロフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、

25 (159) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2,4-ジメトキ

- シフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (160) 8 - (3-ペンチルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-フルオロ-4-メチルフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾ  
5 ロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (161) 8 - (N-ブチル-N- (2-ブチニル) アミノ) - 2-メチル-3  
- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シク  
ロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (162) 8 - (3-メチル-2-ブチルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-メ  
10 チル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d]  
ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (163) 8 - (1-シクロヘキシルエチルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-  
メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ  
[d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 15 (164) 8 - (2-ペンチルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-メチル-4-  
メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾ  
ロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (165) 8 - (2-ヘプチルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-メチル-4-  
メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾ  
20 ロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (166) 8 - (1-メトキシ-2-プロピルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-  
メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペン  
タ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (167) 8 - (2-オクチルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-メチル-4-  
25 メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾ  
ロ [1, 5-a] ピリミジン、

- (168) 8- (1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-1-イル) アミノ-2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (169) 8- ((1S, 2S, 3S, 5R) -2, 6, 6-トリメチルビシクロ [3. 1. 1] -3-ヘプチル) アミノ-2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (170) 8- (3-ペンチルアミノ) -2-メチル-3- (2-メチル-4-クロロフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (171) 8- (3-ペンチルアミノ) -2-メチル-3- (2, 5-ジメトキシフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (172) 8- (3-ペンチルアミノ) -2-メチル-3- (2-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (173) 8- (N-エチル-N- (4-ヒドロキシブチル) アミノ) -2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (174) 8- (3-ペンチルアミノ) -2-メチル-3- (2-メトキシ-5-イソプロピルフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (175) 8- (3-ペンチルアミノ) -2-メチル-3- (2-メトキシ-5-フルオロフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (176) 8- (N-ブチル-N- (4-フルオロフェニル) メチルアミノ) -

- 2-メチル-3-(2-クロロ-5-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (177) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メトキシ-5-クロロフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 5 (178) 8-(N-シクロプロピルメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-5-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 10 (179) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-シアノフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (180) 8-(N-プロピル-N-(2-メトキシエチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-5-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 15 (181) 8-(N-エチル-N-(4-メチルチオフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (182) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(4-メチルチオフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 20 (183) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(4-ジメチルアミノフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 25 (184) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メチルチオフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラ

- ゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (185) 8-(N-(2-メトキシエチル)-N-(2-ブチニル)アミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、
- 5 (186) 8-(N-プロピル-N-(5-メチルフラン-2-イル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、
- (187) 8-(N-ベンジル-N-シクロプロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、
- 10 (188) 8-(N-シクロプロピルメチル-N-(2-メトキシエチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、
- (189) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-ブロモフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、
- 15 (190) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2,5-ジクロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、
- (191) 8-ジブチルアミノ-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、
- 20 (192) 8-ビス(2-メトキシエチル)アミノ-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、
- 25 (193) 8-(N-エチル-N-シクロプロピルメチルアミノ)-2-メチル

- ー3ー(2ークロロー4ーメトキシフェニル)ー6, 7ージヒドロー5Hーシクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5ーa]ピリミジン、
- (194) 8ー(NーシクロプロピルーNー(4ーシアノフェニル)メチルアミノ)ー2ーメチルー3ー(2ークロロー4ーメトキシフェニル)ー6, 7ー
- 5 ジヒドロー5Hーシクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5ーa]ピリミジン、
- (195) 8ー(NーシクロプロピルメチルーNー(4ーシアノフェニル)メチルアミノ)ー2ーメチルー3ー(2ークロロー4ーメトキシフェニル)ー6, 7ージヒドロー5Hーシクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5ーa]ピリミジン、
- 10 (196) 8ー(NーブチルーNーシクロプロピルメチルアミノ)ー2ーメチルー3ー(2ークロロー4ーメトキシフェニル)ー6, 7ージヒドロー5Hーシクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5ーa]ピリミジン、
- (197) 8ー(3ーペンチルアミノ)ー2ーメチルー3ー(2ークロロー4ーエトキシカルボニルフェニル)ー6, 7ージヒドロー5Hーシクロペンタ[d]
- 15 ピラゾロ[1, 5ーa]ピリミジン、
- (198) 8ー(NープロピルーNー(2ーフルオロフェニル)メチルアミノ)ー2ーメチルー3ー(2ークロロー4ーメトキシフェニル)ー6, 7ージヒドロー5Hーシクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5ーa]ピリミジン、
- (199) 8ー(NープロピルーNー(5ーメチルチオフェンー2ーイル)メチルアミノ)ー2ーメチルー3ー(2ークロロー4ーメトキシフェニル)ー6,
- 20 7ージヒドロー5Hーシクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5ーa]ピリミジン、
- (200) 8ー(NープロピルーNー(チオフェンー3ーイル)メチルアミノ)ー2ーメチルー3ー(2ークロロー4ーメトキシフェニル)ー6, 7ージヒ
- 25 ドロー5Hーシクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5ーa]ピリミジン、
- (201) 8ー(NーエチルーNープロピルアミノ)ー2ーメチルー3ー(2ー

- クロロ-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ  
[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、
- (202) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-  
カルバモイルフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピ  
5 ラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、
- (203) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-  
(N-メチルカルバモイル)フェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロ  
ペンタ [d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、
- (204) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-  
10 (N, N-ジメチルカルバモイル)フェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-  
シクロペンタ [d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、
- (205) 8-(N-エチル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ)-  
2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒド  
ロ-5H-シクロペンタ [d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、
- 15 (206) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4,  
6-ジメトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d]  
ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、
- (207) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-  
アミノフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d]ピラゾロ  
20 [1, 5-a]ピリミジン、
- (208) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-  
メチルアミノフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d]ピ  
ラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、
- (209) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-ホルミル-4-  
25 -メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d]ピラ  
ゾロ[1, 5-a]ピリミジン、

- (210) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-シアノ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (211) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-エチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (212) 8-(4-ヘプチルアミノ)-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 10 (213) 8-(N,N-ジプロピルアミノ)-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (214) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メトキシカルボニル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ
- 15 [d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (215) 8-(N-シクロプロピル-N-(2-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (216) 8-(N-シクロプロピルメチル-N-(2-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 20 (217) 8-(N-シクロプロピルメチル-N-プロピルアミノ)-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (218) 8-(N-プロピル-N-(4-メチルフェニル)メチルアミノ)-

- 3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (219) 8- (N-ベンジル-N-シクロプロピルメチルアミノ) -3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペン  
5 タ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (220) 8- (N-シクロプロピルメチル-N- (4-メチルフェニル) メチルアミノ) -3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (221) 8- (N-プロピル-N- (4-フルオロフェニル) メチルアミノ)  
10 -3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (222) 8-ジシクロプロピルメチルアミノ-3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 15 (223) 8- (N-シクロプロピル-N- (4-メチルフェニル) メチルアミノ) -3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (224) 8- (N-シクロプロピルメチル-N- (4-トリフルオロメチルフェニル) メチルアミノ) -3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) -6,  
20 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (225) 8- (3-ペンチルアミノ) -3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 25 (226) 8- (N-シクロプロピルメチル-N- (4-フルオロフェニル) メチルアミノ) -3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒ

- ドロー5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (227) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-(1-メチル-1-ヒドロキシエチル)-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロー5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 5 (228) 8-(N-プロピル-N-(4-トリフルオロメチルオキシフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロー5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (229) 8-(3-ヘキシルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロー5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 10 (230) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メトキシ-4-メチルピリジン-5-イル)-6, 7-ジヒドロー5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (231) 8-(N-ブチル-N-シクロプロピルメチルアミノ)-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロー5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 15 (232) 8-(N-プロピル-N-(4-メチルフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロー5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 20 (233) 8-(N-プロピル-N-(4-シアノフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロー5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (234) 8-(N-シクロプロピルメチル-N-メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロー5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 25

- (235) 8-(N-エチル-N-n-ブチルアミノ)-2-ヒドロキシメチル-3-(2-メチル-4-ヒドロキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (236) 8-(N-エチル-N-n-ブチルアミノ)-2-ヒドロキシメチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (237) 8-(N-プロピル-N-(2-メトキシミノエチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 10 (238) 8-(N-エチル-N-n-ブチルアミノ)-2-ヒドロキシミノメチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (239) 8-[(2S)-1-ヒドロキシミノブタン-2-イル]アミノ-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 15 (240) 8-[(1S)-1-シアノプロピルアミノ]-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (241) 8-(N-エチル-N-n-ブチルアミノ)-2-シアノ-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 20 (242) 1-シアノ-2-メチル-8-(3-ペンチルアミノ)-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピロロ[1,2-a]ピリミジン、
- 25 (243) 1-シアノ-2-メチル-8-ジプロピルアミノ-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]

- ピロロ [1, 2-a] ピリミジン、
- (244) 2, 3-ジメチル-4-アミノ-1-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [e] ピロロ [2, 3-b] ピリジン、
- 5 (245) 2, 3-ジメチル-4-エチルカルボニルアミノ-1-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [e] ピロロ [2, 3-b] ピリジン、
- (246) 2, 3-ジメチル-4-プロピルアミノ-1-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [e] ピロロ [2, 3-b] ピリジン、
- 10 (247) 2, 3-ジメチル-4-(N-エチルカルボニル-N-プロピルアミノ)-1-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [e] ピロロ [2, 3-b] ピリジン、
- (248) 2, 3-ジメチル-4-ジプロピルアミノ-1-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [e] ピロロ [2, 3-b] ピリジン、
- 15 (249) 8-(4-ヘプチルアミノ)-3-(2, 6-ジメチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 20 (250) 8-ジプロピルアミノ-3-(2, 6-ジメチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (251) 8-(N-シクロプロピルメチル-N-プロピルアミノ)-3-(2, 6-ジメチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 25 (252) 8-(N-ベンジル-N-シクロプロピルメチルアミノ)-3-(2,

- 6-ジメチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (253) 8-(N-シクロプロピルメチル-N-(4-メチルフェニルメチル)アミノ)-3-(2, 6-ジメチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (254) 8-(N-プロピル-N-(4-フルオロフェニルメチル)アミノ)-3-(2, 6-ジメチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (255) 8-ジシクロプロピルメチルアミノ-3-(2, 6-ジメチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (256) 8-(N-ブチル-N-シクロプロピルメチルアミノ)-3-(2, 6-ジメチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (257) 8-(N-シクロプロピルメチル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ)-3-(2, 6-ジメチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (258) 2, 3-ジメチル-4-(N-エチル-N-ペンチルアミノ)-1-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [e] ピロロ [2, 3-b] ピリジンから選ばれる請求の範囲1に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

18. 化合物が、

- (1) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロチエノ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、

- (2) 9-(3-ペンチルアミノ)-6-メチル-5-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-2,3-ジヒドロ-チエノ [3, 2-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (3) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (4) 9-(3-ペンチルアミノ)-6-メチル-5-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-2,3-ジヒドロ-フロ [3, 2-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 10 (5) 9-(3-ペンチルアミノ)-6-メチル-5-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-2,3-ジヒドロ-ピロロ [3, 2-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (6) 8-イソプロピルアミノ-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 15 a] ピリミジン、
- (7) 8-[(2S)-1,1-ジメトキシブタン-2-イル]アミノ-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (8) 8-(1,3-ジメトキシプロパン-2-イル)アミノ-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 20 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (9) 8-ビス(2-メトキシエチル)アミノ-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 25 (10) (5RS)-8-(3-ペンチルアミノ)-2,5-ジメチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d]

- ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (11) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 5 (12) 8-(N-プロピル-N-(2-ヒドロキシエチル) アミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (13) 8-シクロプロピルアミノ-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 10 (14) 8-(N-メチル-N-シクロプロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (15) 8-[(2R)-1-メトキシブタン-2-イル] アミノ-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 15 (16) 8-[(2R)-1-メトキシブタン-2-イル] アミノ-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-2, 3-ジヒドロ-ピロロ [3, 2-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 20 (17) 8-(N-シクロプロピルメチル-N-(4-メチルフェニル) メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (18) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-エトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 25 (19) 8-(N-シクロプロピル-N-(4-メチルフェニル) メチルアミノ)

- 2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒ  
 ドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、  
 (20) 8-(N-シクロプロピルメチル-N-(4-メチルフェニル)メチル  
 アミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,  
 5 7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、  
 (21) 8-(N-プロピル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ)-  
 2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒド  
 ロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、  
 (22) 8-(N-シクロプロピルメチル-N-(4-メチルチオフェニル)メ  
 10 チルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-  
 5, 7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、  
 (23) 8-(N, N-ジプロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-  
 4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ  
 [1, 5-a] ピリミジン、  
 15 (24) 8-(N, N-ジブチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-  
 -メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1,  
 5-a] ピリミジン、  
 (25) 8-(N-プロピル-N-(4-メチルフェニル)メチルアミノ)-2  
 -メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロ  
 20 -フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、  
 (26) 8-(N-ブチル-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-ク  
 ロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピ  
 ラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、  
 (27) 8-(4-ヘプチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メ  
 25 トキシフェニル)-5, 7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1,  
 5-a] ピリミジン、

- (28) 8-(N-ブチル-N-エチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (29) 8-ジシクロプロピルメチルアミノ-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (30) 8-(N-シクロプロピルメチル-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 10 (31) 8-(N-(2-ブチニル)-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (32) 8-(N-ブチル-N-(2-メトキシエチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 15 (33) 8-(N-プロピル-N-(4-トリフルオロメチルオキシフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (34) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 20 (35) 8-(N-シクロプロピルメチルアミノ-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 25

- (36) 8-(N-ベンジル-N-(2-ジメチルアミノエチル)アミノ)-2-  
 -メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロ  
 -フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (37) 8-(N-(2-ブチニル)-N-エチルアミノ)-2-メチル-3-  
 5 (2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロフロ [3, 4  
 -d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (38) 8-(N-(2-ブチニル)-N-シクロプロピルメチルアミノ)-2  
 -メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロ  
 -フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 10 (39) 8-(N-シクロプロピル-N-(4-メチルチオフェニル)メチルア  
 ミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7  
 -ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (40) 8-(N-プロピル-N-(4-メチルチオフェニル)メチルアミノ)  
 -2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒ  
 15 ドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (41) 8-(N-シクロプロピル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミ  
 ノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-  
 ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (42) 8-(N-プロピル-N-(3-フルオロフェニル)メチルアミノ)-  
 20 2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒド  
 ローフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (43) 8-(N-プロピル-N-(ベンゾ [d] 1, 3-ジオキサラン-5-  
 イル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェ  
 ニル)-5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピ  
 25 リミジン、
- (44) 8-(N-ベンジル-N-シクロプロピルメチルアミノ)-2-メチル

- 3 — (2-クロロ-4-メトキシフェニル) — 5, 7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (45) 8 — (N-ブチル-N- (2-ブチニル) アミノ) — 2-メチル-3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) — 5, 7-ジヒドロ-フロ [3, 4-  
5 — d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (46) 8-ジシクロプロピルメチルアミノ-2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) — 5, 7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (47) 8 — (N-ブチル-N-エチルアミノ) — 2-メチル-3- (2-メチル-  
10 ル-4-メトキシフェニル) — 5, 7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (48) 8 — (N-ブチル-N-プロピルアミノ) — 2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) — 5, 7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 15 (49) 8 — (N, N-ジプロピルアミノ) — 2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) — 5, 7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (50) 8-ビス (2-メトキシエチル) アミノ-2-メチル-3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) — 5, 7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 20 (51) 8 — (N-ブチル-N- (4-フルオロフェニル) メチルアミノ) — 2-メチル-3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) — 5, 7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (52) 8 — (N-ブチル-N- (4-フルオロフェニル) メチルアミノ) — 2-  
25 —メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) — 5, 7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、

- (53) 8-(N-エチル-N-(2-ブチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (54) 8-(N-プロピル-N-(2-ブチル)アミノ)-2-メチル-3-  
5-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (55) 8-(N-プロピル-N-(4-メチルチオフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 10 (56) 8-(N-プロピル-N-(ベンゾ[d]1,3-ジオキサラン-5-イル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (57) 8-(N-ベンジル-N-シクロプロピルメチルアミノ)-2-メチル-  
15-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (58) 8-(N-シクロプロピルメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピ  
20リミジン、
- (59) 8-(N-シクロプロピルメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピ  
リミジン、
- 25 (60) 8-(N-プロピル-N-(4-シアノフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ

- ーフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (61) 8- (N-シクロプロピル-N- (4-フルオロフェニル) メチルアミノ) -2-メチル-3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) -5, 7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 5 (62) 8- (N-シクロプロピル-N- (4-フルオロフェニル) メチルアミノ) -2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) -5, 7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (63) 8- (N-シクロプロピルメチル-N- (4-フルオロフェニル) メチルアミノ) -2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) -5,
- 10 7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (64) 8- (N-プロピル-N- (2-メトキシエチル) アミノ) -2-メチル-3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) -5, 7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (65) 8- (N-プロピル-N- (2-メトキシエチル) アミノ) -2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) -5, 7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 15 (66) 8- (N-エチル-N- (4-メチルチオフェニル) メチルアミノ) -2-メチル-3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) -5, 7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (67) 8- (N-エチル-N- (4-メチルチオフェニル) メチルアミノ) -2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) -5, 7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 20 (68) 8- (N-ブチル-N- (2-メトキシエチル) アミノ) -2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) -5, 7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 25 (69) 8- (N-シクロプロピルメチル-N-プロピルアミノ) -2-メチル

- 3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、  
 (70) 8-(N-プロピル-N-(5-メチルフラン-2-イル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、  
 5 (71) 8-(N-プロピル-N-(5-メチルフラン-2-イル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、  
 (72) 8-(N-シクロプロピルメチル-N-(2-メトキシエチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、  
 10 (73) 8-(N-プロピル-N-(4-トリフルオロメチルオキシフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、  
 15 (74) 8-(N-プロピル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、  
 (75) 8-(N-シクロプロピルメチル-N-(2-ブチニル)アミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、  
 20 (76) 8-(N-(2-メトキシエチル)-N-(2-ブチニル)アミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、  
 25 (77) 8-(N-(2-メトキシエチル)-N-(2-ブチニル)アミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒド

- ローフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (78) 8-(N-ベンジル-N-シクロプロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 5 (79) 8-(N-ベンジル-N-シクロプロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (80) 8-(N-シクロプロピルメチル-N-(2-メトキシエチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒ  
10 ドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (81) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2, 5-ジクロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (82) 8-(N-シクロプロピル-N-(4-シアノフェニル)メチルアミノ)  
15 -2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (83) 8-(N-シクロプロピル-N-(4-シアノフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒ  
ドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 20 (84) 8-ジブチルアミノ-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (85) 8-(N-エチル-N-シクロプロピルメチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロフロ [3,  
25 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (86) 8-(N-エチル-N-シクロプロピルメチルアミノ)-2-メチル-

- 3 - (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (87) 8 - (N-シクロプロピルメチル-N-(4-シアノフェニル) メチルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (88) 8 - (N-シクロプロピルメチル-N-(4-シアノフェニル) メチルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (89) 8 - (N-プロピル-N-(チオフェン-3-イル) メチルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (90) 8 - (N-プロピル-N-(5-メチルチオフェン-2-イル) メチルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (91) 8 - (N-ブチル-N-シクロプロピルメチルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (92) 8 - (N-ブチル-N-シクロプロピルメチルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (93) 8 - (N-プロピル-N-(チオフェン-3-イル) メチルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (94) 8 - (N-プロピル-N-(5-メチルチオフェン-2-イル) メチルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、

- (95) 8-(N-プロピル-N-(2-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (96) 8-(N-プロピル-N-(2-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (97) 8-(N-エチル-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 10 (98) 8-(N-エチル-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (99) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2,6-ジメチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ
- 15 [1,5-a]ピリミジン、
- (100) 8-(N-エチル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (101) 8-(N-エチル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 20 (102) 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4,6-ジメトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 25 (103) 8-(4-ヘプチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,

- 5-a] ピリミジン、
- (104) 8-(N,N-ジプロピルアミノ)-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 5 (105) 8-(N-シクロプロピルメチル-N-プロピルアミノ)-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (106) 8-(N-ベンジル-N-シクロプロピルメチルアミノ)-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]
- 10 ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (107) 8-(N-シクロプロピルメチル-N-(4-メチルフェニル)メチルアミノ)-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (108) 8-(N-プロピル-N-(2-ブチル)アミノ)-3-(2-クロ
- 15 ロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (109) 8-(N-ブチル-N-シクロプロピルメチルアミノ)-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 20 (110) 8-(3-ペンチルアミノ)-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (111) 8-(N-シクロプロピルメチル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ)-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒ
- 25 ドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (112) 8-(4-ヘプチルアミノ)-3-(2-クロロ-4-メトキシフェ

- ニル) - 5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (113) 8 - (N-プロピル-N- (4-メチルフェニル) メチルアミノ) - 3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ [3, 5 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (114) 8 - (N-プロピル-N- (4-フルオロフェニル) メチルアミノ) - 3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (115) 8-ジシクロプロピルメチルアミノ-3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 10 (116) 8 - (N-シクロプロピルメチル-N- (4-トリフルオロメチルフェニル) メチルアミノ) - 3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 15 (117) 8 - (N-シクロプロピル-N- (4-メチルフェニル) メチルアミノ) - 3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (118) 8 - (N-プロピル-N- (4-シアノフェニル) メチルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 20 (119) 8 - (N-シクロプロピルメチル-N-メチルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (120) 8 - (N-シクロプロピルメチル-N-メチルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 25

- (121) 8- (N-プロピル-N- (2-メトキシイミノエチル) アミノ) -  
2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) -5, 7-ジヒド  
ローフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (122) 8- [ (2S) -1-メトキシイミノブタン-2-イル] アミノ-2  
5-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) -5, 7-ジヒド  
ローフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (123) 9- (3-ペンチルアミノ) -6-メチル-5- (2-メチル-4-  
メトキシフェニル) -フロ [3, 2-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジ  
ンから選ばれる請求の範囲1に記載の化合物、その薬学的に許容される塩ま  
10 たはそれらの水和物。

19. 化合物が、

- (1) 8-ヒドロキシ-2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニ  
ル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a]  
15 ピリミジン、
- (2) 2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) -8- [ (2  
S, 4R) -4-メトキシ-2-メトキシメチルピロリジン-1-イル] -  
6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリ  
ミジン、
- 20 (3) 8- (1, 2, 5, 6-テトラヒドロピリジル) -2-メチル-3- (2  
-メチル-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペン  
タ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (4) 8- (1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) -2-  
メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒドロ-  
25 5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (5) 8- ( (3S) -3-メトキシメチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ

- イソキノリン-2-イル) - 2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (6) 8- (4-フェニルピペラジン-1-イル) - 2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、 2
- (7) 8- (4- (2-クロロフェニル) ピペラジン-1-イル) - 2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 10 (8) 8- (3-エトキシカルボニル-1, 2, 5, 6-テトラヒドロピリジル) - 2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (9) 8- (3- (3-メチル-1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イル) -1, 2, 5, 6-テトラヒドロピリジル) - 2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 15 (10) 8- (4- (4-クロロフェニル) -1, 2, 5, 6-テトラヒドロピリジル) - 2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 20 (11) 8- (3-ペンチルオキシ) - 2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (12) 8- (3-ペンチルオキシ) - 2-メチル-3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 25

- (13) 8-(4-ヘプチルオキシ)-2-メチル-3-(2-クロロ-5-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (14) 8-イソプロピルオキシ-2-メチル-3-(2-クロロ-5-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (15) 8-(1,6-ヘプタジエン-4-イル)オキシ-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 10 (16) 8-(3-ペンチルチオ)-2-メチル-3-(2-クロロ-5-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (17) 8-(4-メチルフェニル)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ
- 15 [1,5-a]ピリミジン、
- (18) 8-(2,4-ジクロロフェニル)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (19) 8-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]
- 20 ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- (20) 8-(4-メトキシフェニル)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、
- 25 (21) 8-(3,5-ジクロロフェニル)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、

- ラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (22) 8-(2-メチルフェニル)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 5 (23) 8-ビス(エトキシカルボニル)メチル-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (24) 8-(1-ジメチルアミノ-1, 3-ジオキソ-2-ブチル)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5
- 10 H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (25) 8-(2, 4-ジオキソ-3-ペンチル)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (26) 8-ビス(エトキシカルボニル)メチル-2-メチル-3-(2-クロ
- 15 ロ-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (27) 8-(1, 3-ヒドロキシ-2-プロピル)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- 20 (28) 8-(1, 3-ジメトキシ-2-プロピル)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (29) 8-(N, N-ジメチルカルバモイルメチル)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペン
- 25 タ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン、
- (30) 1-シアノ-2-メチル-8-ヒドロキシ-3-(2-クロロ-4-メ

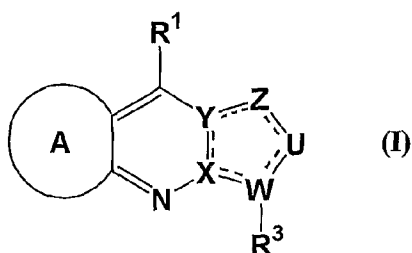
トキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピロロ[1, 2-a]ピリミジンから選ばれる請求の範囲1に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

5 20. 化合物が、

- (1) 6-メチル-5-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-9-[(2 S, 4 R)-4-メトキシ-2-メトキシメチルピロリジン-1-イル]-2, 3-ジヒドロフロ[3, 2-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、  
(2) 2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-8-[(2 S, 4 R)-4-メトキシ-2-メトキシメチルピロリジン-1-イル]-5, 7-ジヒドロフロ[3, 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、  
(3) 6-メチル-5-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-9-[(2 S, 4 R)-4-メトキシ-2-メトキシメチルピロリジン-1-イル]-2, 3-ジヒドロピロロ[3, 2-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、  
(4) 8-(3-ペンチルオキシ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロフロ[3, 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン、  
(5) 8-ビス(エトキシカルボニル)メチル-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロフロ[3, 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジンから選ばれる請求の範囲1に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

21. 請求の範囲1に記載の一般式(I)で示される化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物を含有する医薬品組成物。

## 22. 一般式 (I)



(式中、

XおよびYはそれぞれ独立して、炭素原子または窒素原子を表わし（ただし、

5 二つは同時に窒素原子を表わさない。） 、

Wは炭素原子または窒素原子を表わし、

UおよびZはそれぞれ独立して、 $CR^2$ 、 $NR^{13}$ 、窒素原子、酸素原子、硫黄原子、 $C=O$ または $C=S$ を表わし、

$R^2$ は

10 (i)水素原子、

(ii) C 1～8アルキル、

(iii) C 2～8アルケニル、

(iv) C 2～8アルキニル、

(v)ハロゲン原子、

15 (vi)  $CF_3$ 、

(vii)シアノ、

(viii)ニトロ、

(ix)  $NR^9R^{10}$ （基中、 $R^9$ および $R^{10}$ はそれぞれ独立して、

(i)水素原子、

20 (ii) C 1～4アルキル、

(iii) C 3～10の単環もしくは二環式炭素環、

(iv) 1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個

- の硫黄原子を含有する 3 ～ 10 員の単環もしくは二環式複素環、または
- (v) C 3 ～ 10 の単環もしくは二環式炭素環で、もしくは 1 ～ 4 個の窒素原子、1 ～ 2 個の酸素原子および／または 1 ～ 2 個の硫黄原子を含有する 3 ～ 10 員の単環もしくは二環式複素環で置換された C 1 ～ 4 アルキルを表わす。)、
- 5 (x)  $OR^{11}$  (基中、 $R^{11}$ は
- (i) 水素原子、
- (ii) C 1 ～ 4 アルキル、
- (iii) C 5 ～ 6 の炭素環、
- 10 (iv) 1 ～ 2 個の窒素原子、1 個の酸素原子および／または 1 個の硫黄原子を含有する 5 または 6 員の複素環、または
- (v) C 5 ～ 6 の炭素環もしくは 1 ～ 2 個の窒素原子、1 個の酸素原子および／または 1 個の硫黄原子を含有する 5 または 6 員の複素環で置換された C 1 ～ 4 アルキルを表わす。)、
- 15 (xi) SH、
- (xii)  $S(O)_nR^{12}$  (基中、n は 0、1 または 2 を表わし、 $R^{12}$ は
- (i) C 1 ～ 4 アルキル、
- (ii) C 5 ～ 6 の炭素環、
- (iii) 1 ～ 2 個の窒素原子、1 個の酸素原子および／または 1 個の硫黄原子を含有する 5 または 6 員の複素環、または
- 20 (iv) C 5 ～ 6 の炭素環もしくは 1 ～ 2 個の窒素原子、1 個の酸素原子および／または 1 個の硫黄原子を含有する 5 または 6 員の複素環で置換された C 1 ～ 4 アルキルを表わす。)、
- (xiii)  $COR^{11}$ 、
- 25 (xiv)  $COOR^{11}$ 、
- (xv)  $CONR^9R^{10}$ 、

- (xvi) C 3 ~ 1 0 の単環もしくは二環式炭素環、
- (xvii) 1 ~ 4 個の窒素原子、1 ~ 2 個の酸素原子および／または 1 ~ 2 個の硫黄原子を含有する 3 ~ 1 0 員の単環もしくは二環式複素環、または
- (xviii) ハロゲン原子、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、シアノ、ニトロ、NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>、OR<sup>11</sup>、=N-OR<sup>11</sup>、SH、S(O)<sub>n</sub>R<sup>12</sup>、COR<sup>11</sup>、COOR<sup>11</sup>、CONR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>、C 3 ~ 1 0 の単環もしくは二環式炭素環、および 1 ~ 4 個の窒素原子、1 ~ 2 個の酸素原子および／または 1 ~ 2 個の硫黄原子を含有する 3 ~ 1 0 員の単環もしくは二環式複素環から選ばれる基 1 ~ 2 個で置換されている C 1 ~ 4 アルキルを表わし、
- 10 R<sup>13</sup>は
- (i) 水素原子、
- (ii) C 1 ~ 4 アルキル、
- (iii) C 2 ~ 4 アルケニル、
- (iv) C 2 ~ 4 アルキニル、
- 15 (v) C 3 ~ 1 0 の単環もしくは二環式炭素環、
- (vi) 1 ~ 4 個の窒素原子、1 ~ 2 個の酸素原子および／または 1 ~ 2 個の硫黄原子を含有する 3 ~ 1 0 員の単環もしくは二環式複素環、または
- (vii) C 3 ~ 1 0 の単環もしくは二環式炭素環で、または 1 ~ 4 個の窒素原子、1 ~ 2 個の酸素原子および／または 1 ~ 2 個の硫黄原子を含有する 3 ~ 1 0
- 20 員の単環もしくは二環式複素環で置換されている C 1 ~ 4 アルキルを表わし、  
 ≡ は単結合または二重結合を表わし、



- は C 1 ~ 4 アルキル、C 1 ~ 4 アルコキシ、ハロゲン原子および CF<sub>3</sub> から選ばれる基 1 ~ 3 個で置換されているか、もしくは無置換の C 4 ~ 6 炭素環、
- 25 または窒素原子、酸素原子または硫黄原子を少なくとも 1 個含有する 4 ~ 6

員の複素環を表わし、

$R^1$ は

- (i) 1～5個の $R^{14}$ で置換されているかもしくは無置換のC 1～8アルキル、
- (ii) 1～5個の $R^{14}$ で置換されているかもしくは無置換のC 2～8アルケニ  
5 ル、
- (iii) 1～5個の $R^{14}$ で置換されているかもしくは無置換のC 2～8アルキニ  
ル、
- (iv)  $NR^4R^5$  (基中、 $R^4$ および $R^5$ はそれぞれ独立して、
  - (i) 水素原子、
  - 10 (ii) 1～5個の $R^{17}$ で置換されているかもしくは無置換のC 1～15ア  
ルキル、
  - (iii) 1～5個の $R^{17}$ で置換されているかもしくは無置換のC 2～15  
アルケニル、
  - (iv) 1～5個の $R^{17}$ で置換されているかもしくは無置換のC 2～15  
15 アルキニル、
  - (v) 1～5個の $R^{18}$ で置換されているかもしくは無置換のC 3～15の  
単環もしくは二環式炭素環、
  - (vi) 1～5個の $R^{18}$ で置換されているかもしくは無置換の1～4個の  
窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含  
20 有する3～15員の単環もしくは二環式複素環を表わす。) 、
- (v)  $OR^6$  (基中、 $R^6$ は
  - (i) 水素原子、
  - (ii) C 1～10アルキル、
  - (iii) C 2～10アルケニル、
  - 25 (iv) C 2～10アルキニル、
  - (v) 1～5個の $R^{18}$ で置換されているかもしくは無置換のC 3～15の

単環もしくは二環式炭素環、

(vi) 1～5個の $R^{18}$ で置換されているかもしくは無置換の1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する3～15員の単環もしくは二環式複素環、または

- 5 (vii) ハロゲン原子、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、シアノ、ニトロ、 $NR^9R^{10}$ 、 $OR^{11}$ 、 $=N-OR^{11}$ 、SH、 $S(O)_nR^{12}$ 、 $COR^{11}$ 、 $COOR^{11}$ 、 $CONR^9R^{10}$ 、1～5個の $R^{18}$ で置換されているかもしくは無置換のC3～10の単環もしくは二環式炭素環、および1～5個の $R^{18}$ で置換されているかもしくは無置換の1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する3～10員の単環もしくは二環式複素環から選ばれる基1～2個で置換されているC1～4アルキルを表わす。)、
- 10

(vi) SH、

(vii)  $S(O)_nR^7$  (基中、nは前記と同じ意味を表わし、 $R^7$ は

- 15 (i) C1～8アルキル、
- (ii) 1～5個の $R^{18}$ で置換されているかもしくは無置換のC3～10の単環もしくは二環式炭素環、
- (iii) 1～5個の $R^{18}$ で置換されているかもしくは無置換の1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する3～10員の単環もしくは二環式複素環、または
- 20 (iv) 1～5個の $R^{18}$ で置換されているかもしくは無置換のC3～10の単環もしくは二環式炭素環で、または1～5個の $R^{18}$ で置換されているかもしくは無置換の1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する3～10員の単環もしくは二環式複素環で置換されたC1～4アルキルを表わす。)、
- 25

(viii)  $COR^6$ 、

- (ix)  $\text{COOR}^6$ 、  
 (x)  $\text{CONR}^4\text{R}^5$ 、  
 (xi)  $\text{NR}^8\text{COR}^6$ 、  
 (xii)  $\text{NR}^8\text{COOR}^6$  (基中、 $\text{R}^6$ は前記と同じ意味を表わし、 $\text{R}^8$ は
- 5 (i) 水素原子、  
 (ii)  $\text{C}1 \sim 8$  アルキル、  
 (iii)  $\text{C}2 \sim 8$  アルケニル、  
 (iv)  $\text{C}2 \sim 8$  アルキニル、  
 (v)  $1 \sim 5$  個の  $\text{R}^{18}$  で置換されているかもしくは無置換の  $\text{C}3 \sim 10$  の
- 10 単環もしくは二環式炭素環、  
 (vi)  $1 \sim 5$  個の  $\text{R}^{18}$  で置換されているかもしくは無置換の  $1 \sim 4$  個の窒素原子、 $1 \sim 2$  個の酸素原子および／または  $1 \sim 2$  個の硫黄原子を含有する  $3 \sim 10$  員の単環もしくは二環式複素環、または
- (vii) ハロゲン原子、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{OCF}_3$ 、シアノ、ニトロ、 $\text{NR}^9\text{R}^{10}$ 、 $\text{OR}^{11}$ 、 $=\text{N}-\text{OR}^{11}$ 、 $\text{SH}$ 、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^{12}$ 、 $\text{COR}^{11}$ 、 $\text{COOR}^{11}$ 、  
 15  $\text{CONR}^9\text{R}^{10}$ 、 $1 \sim 5$  個の  $\text{R}^{18}$  で置換されているかもしくは無置換の  $\text{C}3 \sim 10$  の単環もしくは二環式炭素環、および  $1 \sim 5$  個の  $\text{R}^{18}$  で置換されているかもしくは無置換の  $1 \sim 4$  個の窒素原子、 $1 \sim 2$  個の酸素原子および／または  $1 \sim 2$  個の硫黄原子を含有する  $3 \sim 10$  員の単環も
- 20 しくは二環式複素環から選ばれる基  $1 \sim 2$  個で置換されている  $\text{C}1 \sim 4$  アルキルを表わす。)、
- (xiii)  $\text{NR}^8\text{CONR}^4\text{R}^5$ 、  
 (xiv)  $1 \sim 5$  個の  $\text{R}^{15}$  で置換されているかもしくは無置換の  $\text{C}3 \sim 15$  の単環もしくは二環式炭素環、または
- 25 (xv)  $1 \sim 5$  個の  $\text{R}^{15}$  で置換されているかもしくは無置換の  $1 \sim 4$  個の窒素原子、 $1 \sim 2$  個の酸素原子および／または  $1 \sim 2$  個の硫黄原子を含有する  $3 \sim$

1 5 員の単環もしくは二環式複素環を表わし、

$R^{14}$ は(a)ハロゲン原子、(b) $CF_3$ 、(c) $OCF_3$ 、(d)シアノ、(e)ニトロ、  
(f) $NR^4R^5$ 、(g) $OR^6$ 、(h) $=N-OR^6$ 、(j)SH、(k) $S(O)_nR^7$ 、(l) $COR^6$ 、  
5 (m) $COOR^6$ 、(n) $CONR^4R^5$ 、(o) $NR^8COR^6$ 、(p) $NR^8COR^6$ 、(q) $NR^8CONR^4R^5$ 、(r) 1～5個の $R^{15}$ で置換されているかもし  
くは無置換のC 3～1 5の単環もしくは二環式炭素環、または(s) 1～5個の  
 $R^{15}$ で置換されているかもしくは無置換の1～4個の窒素原子、1～2個の  
酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する3～1 5員の単環も  
しくは二環式複素環を表わし、

10  $R^{15}$ は(a) C 1～8アルキル、(b) C 2～8アルケニル、(c) C 2～8アルキ  
ニル、(d) C 1～4アルコキシ (C 1～4) アルキル、(e)ハロゲン原子、(f)  
 $CF_3$ 、(g) $OCF_3$ 、(h)シアノ、(j)ニトロ、(k) $NR^4R^5$ 、(l) $OR^6$ 、(m)  
SH、(n) $S(O)_nR^7$ 、(o) $COR^6$ 、(p) $COOR^6$ 、(q) $CONR^4R^5$ 、(r)  
 $NR^8COR^6$ 、(s) $NR^8COOR^6$ 、(t) $NR^8CONR^4R^5$ 、(u) 1～5個の  
15  $R^{20}$ で置換されているかもしくは無置換のC 3～1 0の単環もしくは二環式  
炭素環、(v) 1～5個の $R^{20}$ で置換されているかもしくは無置換の1～4個の  
窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有す  
る3～1 0員の単環もしくは二環式複素環、(w)ハロゲン原子、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、  
シアノ、ニトロ、 $NR^4R^5$ 、 $OR^6$ 、 $=N-OR^6$ 、SH、 $S(O)_nR^7$ 、  
20  $COR^6$ 、 $COOR^6$ 、 $CONR^4R^5$ 、 $NR^8COR^6$ 、 $NR^8COOR^6$ 、 $NR^8CONR^4R^5$ 、1～5個の $R^{20}$ で置換されているかもしくは無置換のC 3  
～1 0の単環もしくは二環式炭素環、および1～5個の $R^{20}$ で置換されてい  
るかもしくは無置換の1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／ま  
たは1～2個の硫黄原子を含有する3～1 0員の単環もしくは二環式複素環  
25 から選ばれる基1～2個で置換されているC 1～4アルキルを表わし、

$R^{17}$ は(a)ハロゲン原子、(b) $CF_3$ 、(c) $OCF_3$ 、(d)シアノ、(e)ニトロ、

(f)  $\text{NR}^9\text{R}^{10}$ 、(g)  $\text{OR}^{11}$ 、(h)  $=\text{N}-\text{OR}^{11}$ 、(j)  $\text{SH}$ 、(k)  $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^{12}$ 、  
 (l)  $\text{COR}^{11}$ 、(m)  $\text{COOR}^{11}$ 、(n)  $\text{CONR}^9\text{R}^{10}$ 、(o)  $\text{NR}^8\text{COR}^{11}$ 、(p)  
 $\text{NR}^8\text{COOR}^{11}$ 、(q)  $\text{NR}^8\text{CONR}^9\text{R}^{10}$ 、(r) 1～5個の $\text{R}^{18}$ で置換され  
 5 (s) 1～5個の $\text{R}^{18}$ で置換されているかもしくは無置換の1～4個の窒素原  
 子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する3～  
 15員の単環もしくは二環式複素環を表わし、

$\text{R}^{18}$ は(a) C 1～4アルキル、(b) C 2～4アルケニル、(c) C 2～4アルキ  
 ニル、(d) ハロゲン原子、(e)  $\text{CF}_3$ 、(f)  $\text{OCF}_3$ 、(g) シアノ、(h) ニトロ、(j)  
 10  $\text{SH}$ 、(k)  $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^{12}$ 、(l)  $\text{NR}^9\text{R}^{10}$ 、(m)  $\text{OR}^{11}$ 、(n)  $\text{COR}^{11}$ 、(o)  $\text{CO}$   
 $\text{OR}^{11}$ 、(p)  $\text{CONR}^9\text{R}^{10}$ 、(q) C 5～6の炭素環、(r) 1～2個の窒素原子、  
 1個の酸素原子および／または1個の硫黄原子を含有する5または6員の複  
 素環、または(s) C 5～6の炭素環または1～2個の窒素原子、1個の酸素原  
 子および／または1個の硫黄原子を含有する5または6員の複素環で置換さ  
 15 れたC 1～4アルキルで置換されたC 1～4アルキル表わし、

$\text{R}^{19}$ はC 1～4アルキル、C 1～4アルコキシ、ハロゲン原子、 $\text{CF}_3$ 、O  
 $\text{CF}_3$ 、シアノ、ニトロ、アミノ、 $\text{NH}$  (C 1～4アルキル)、またはN (C  
 1～4アルキル)<sub>2</sub>を表わし、

$\text{R}^3$ は(i) 1～5個の $\text{R}^{16}$ によって置換されているC 5～10の単環もしく  
 20 は二環式炭素環、または  
 (ii) 1～5個の $\text{R}^{16}$ によって置換されている1～4個の窒素原子、1～2個  
 の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する5～10員の単環  
 もしくは二環式複素環を表わし、

$\text{R}^{16}$ は、

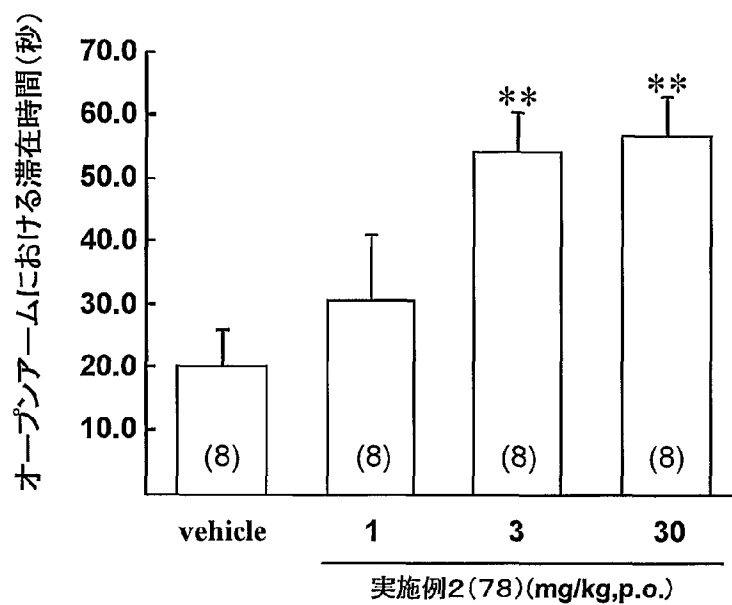
25 (a) C 1～8アルキル、  
 (b) C 2～8アルケニル、

- (c) C<sub>2</sub>～8アルキニル、
- (d)ハロゲン原子、
- (e) CF<sub>3</sub>、
- (f) OCF<sub>3</sub>、
- 5 (g)シアノ、
- (h)ニトロ、
- (j) NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>、
- (k) OR<sup>11</sup>、
- (l) SH、
- 10 (m) S(O)<sub>n</sub>R<sup>12</sup>、
- (n) COR<sup>11</sup>、
- (o) COOR<sup>11</sup>、
- (p) CONR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>、
- (q) NR<sup>8</sup>COR<sup>11</sup>、
- 15 (r) NR<sup>8</sup>COOR<sup>11</sup>、
- (s) NR<sup>8</sup>CONR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>、
- (t) C<sub>3</sub>～10の単環もしくは二環式炭素環、
- (u) 1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する3～10員の単環もしくは二環式複素環、または
- 20 (w)ハロゲン原子、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、シアノ、ニトロ、NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>、OR<sup>11</sup>、  
=N-OR<sup>11</sup>、SH、S(O)<sub>n</sub>R<sup>12</sup>、COR<sup>11</sup>、COOR<sup>11</sup>、CONR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>、  
NR<sup>8</sup>COR<sup>11</sup>、NR<sup>8</sup>COOR<sup>11</sup>、NR<sup>8</sup>CONR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>、C<sub>3</sub>～10の  
単環もしくは二環式炭素環、および1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子  
および／または1～2個の硫黄原子を含有する3～10員の単環もしくは
- 25 二環式複素環から選ばれる基1～2個で置換されているC<sub>1</sub>～4アルキルを  
表わす。)で示される化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水

和物を有効成分として含有するコルチコトロピン放出因子の分泌異常によって引き起こされる疾患の治療および／または予防剤。

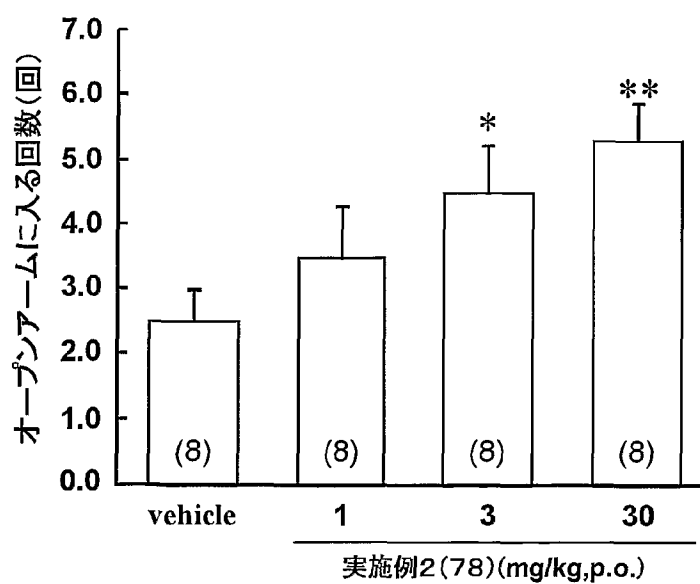
23. コルチコトロピン放出因子の分泌異常によって引き起こされる疾患
- 5 が、うつ病、単一エピソードうつ病、再発性うつ病、分娩後うつ病、小児虐待誘発性うつ病、不安症、不安障害（パニック障害、特定の恐怖症、高所恐怖症、社会恐怖、強迫性障害）、感情障害、双極性障害、心的外傷後ストレス、消化性潰瘍、下痢、便秘、過敏性腸症候群、炎症性腸疾患（潰瘍性大腸炎、クローン病）、ストレスに伴う胃腸機能障害、神経性嘔吐、摂食異常（神経性食欲不振、過食症）、肥満症、ストレス誘発性睡眠障害、繊維筋痛性睡眠障害、ストレス誘導性免疫抑制、ストレス誘発性頭痛、ストレス誘発性熱、ストレス誘発性疼痛、手術襲撃ストレス、慢性関節リウマチ、変形性骨関節症、骨粗鬆症、乾癬、甲状腺機能障害症候群、ブドウ膜炎、喘息、不適切な抗下痢ホルモンに基づく症状、疼痛、炎症、アレルギー性疾患、頭部損傷、
- 10 脊髄損傷、虚血性ニューロン損傷、分泌毒性ニューロン損傷、クッシング病、発作、痙攣、筋痙攣、てんかん虚血性疾患、パーキンソン病、ハンティングトン病、尿失禁、アルツハイマー病、アルツハイマー型老人性痴呆、多梗塞性痴呆症、筋萎縮性側索硬化症、低血糖症、心血管または心臓関連疾患（高血圧、頻脈、うつ血性心不全）、薬物またはアルコールの禁断症状である請
- 15 求の範囲22に記載の治療剤および／または治療剤。
- 20

図 1



\*\*p<0.01 (Mann-Whitney U 検定)

図 2



\*p<0.05, \*\*p<0.01  
(Mann-Whitney U 検定)

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP01/11581

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER  
(See extra sheet.)

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl<sup>7</sup> C07D471/04, 487/04, 487/14, 491/147, 495/14, A61K31/437, 31/519

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)  
CAPLUS (STN), REGISTRY (STN)

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X A	Leach, Colin A., et al., "Reversible Inhibitors of the Gastric(H <sup>+</sup> /K <sup>+</sup> )-ATPase. 2. 1-Arylpyrrolo[3,2-c]quinolines: Effect of the 4-Substituent", J. Med. Chem., Vol.35, No.10, 1992, Pages 1845 to 1852	1,5,6,8,17, 21-23 2-4,7,9-16, 18-20
X A	Sivakamasundari, S., et al., "Pyrroloquinolines. Part IV. Synthesis of 1-aryl-1H-pyrrolo[2,3-b]quinolines", Indian J. Chem., Sect.B, Vol.26B, No.8, 1987, pages 744 to 747	1,5,6,8,17 2-4,7,9-16, 18-23
X A	Smith, Leon, et al., "A Novel and highly efficient synthesis of the aza analogs of tacrine", Tetrahedron Lett., Vol.40, No.31, 1999, pages 5643 to 5646	1,5,6,8,17 2-4,7,9-16, 18-23
X A	Hirbert, Gerhard, et al., "(Aminoethynyl) metallierungen, 14. Cyclisierung von N <sup>1</sup> , N <sup>2</sup> -Diaryl-N <sup>1</sup> -Phenacyl-3-aminopropiolamidinen", Liebigs Ann. Chem., (1985), (7), pages 1389 to 1397	1,5,6,8,17 2-4,7,9-16, 18-23

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C.☐ See patent family annex.

\* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&amp;" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search  
02 April, 2002 (02.04.02)Date of mailing of the international search report  
09 April, 2002 (09.04.02)Name and mailing address of the ISA/  
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP01/11581

## C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO, 97/11946, A1 (Otsuka Pharmaceutical Factory, Inc.),	1-3,6,8-10,
A	03 April, 1997 (03.04.97), (Full text) & CA 2206080 A & EP 795555 A1 & CN 1169149 A & US 5843951 A	17-23 4,5,7,11-16
A	WO, 92/06096, A1 (Otsuka Pharmaceutical Factory, Inc.), 16 April, 1992 (16.04.92), (Full text) & AU 3877593 A & CN 1060844 A & EP 503099 A1 & JP 5-948 A & JP 5-112571 A & US 5420128 A	1-23

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International application No.

PCT/JP01/11581

**Continuation of A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER**  
(International Patent Classification (IPC))

Int.Cl<sup>7</sup> C07D471/04, 487/04, 487/14, 491/147, 495/14, A61K31/437,  
31/519, A61P1/00, 1/04, 1/08, 1/14, 3/04, 3/08, 5/14, 9/00,  
9/02, 9/06, 9/10, 9/12, 11/06, 17/06, 19/02, 19/10, 25/00,  
25/06, 25/08, 25/14, 25/16, 25/20, 25/22, 25/24, 25/28,  
25/30, 27/02, 29/00, 37/08, 43/00  
(According to International Patent Classification (IPC) or to both  
national classification and IPC)

## (Subject of search)

Claim 1 involves a great number of compounds in its scope. However, it is recognized that only small part of the claimed compounds are exclusively supported by the description under the provision of Article 6 of the PCT and disclosed therein under the provision of Article 5 of the PCT.

Therefore, the search has been practiced on the part supported by the description and disclosed therein, namely, the compounds of the general formula (I) wherein A is a 5-membered or 6-membered carbon ring or heterocycle; the fused ring moiety other than A has a pyrazolo[1,5-a]pyrimidine structure, a pyrrolo[1,2-a]pyrimidine structure or a pyrrolo[2,3-b]pyrimidine structure; and R<sub>3</sub> is a phenyl group or a pyridyl group.

The same applies to claims 2 to 23.

## A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl<sup>7</sup> C07D471/04, 487/04, 487/14, 491/147, 495/14, A61K31/437, 31/519, A61P1/00, 1/04, 1/08, 1/14, 3/04, 3/08, 5/14, 9/00, 9/02, 9/06, 9/10, 9/12, 11/06, 17/06, 19/02, 19/10, 25/00, 25/06, 25/08, 25/14, 25/16, 25/20, 25/22, 25/24, 25/28, 25/30, 27/02, 29/00, 37/08, 43/00

## B. 調査を行った分野

## 調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl<sup>7</sup> C07D471/04, 487/04, 487/14, 491/147, 495/14, A61K31/437, 31/519

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)  
CAPLUS (STN), REGISTRY (STN)

## C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X A	Leach, Colin A., et al., 'Reversible Inhibitors of the Gastric (H <sup>+</sup> /K <sup>+</sup> )-ATPase. 2. 1-Arylpyrrolo[3,2-c]quinolines: Effect of the 4-Substituent' J. Med. Chem., Vol. 35, No. 10, 1992, p. 1845-1852	1, 5, 6, 8, 17 21-23 2-4, 7, 9-16 18-20
X A	Sivakamasundari, S., et al. 'Pyrroloquinolines. Part IV. Synthesis of 1-aryl-1H-pyrrolo[2,3-b]quinolines' Indian J. Chem., Sect. B, Vol. 26B, No. 8, 1987, p. 744-747	1, 5, 6, 8, 17 2-4, 7, 9-16 18-23

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

## \* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの  
「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの  
「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)  
「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献  
「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの  
「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの  
「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの  
「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

02.04.02

国際調査報告の発送日

09.04.02

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

胡田 尚則

4P

7918

電話番号 03-3581-1101 内線 3491

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	Smith, Leon, et al., 'A Novel and highly efficient synthesis of the aza analogs of tacrine'	1, 5, 6, 8, 17
A	Tetrahedron Lett., Vol. 40, No. 31, 1999, p. 5643-5646	2-4, 7, 9-16 18-23
X	Hirbert, Gerhard, et al., '(Aminoethinyl)metallierungen, 14. Cyclisierung von N <sup>1</sup> , N <sup>2</sup> -Diaryl-N <sup>1</sup> -Phenacyl-3-aminopropiolamidinen'	1, 5, 6, 8, 17
A	Liebigs Ann. Chem., (1985), (7), p. 1389-1397	2-4, 7, 9-16 18-23
X	WO 97/11946 A1 (株式会社大塚製薬工場) 1997. 04. 03 (全文参照)	1-3, 6, 8-10
A	& CA 2206080 A & EP 795555 A1 & CN 1169149 A & US 5843951 A	17-23 4, 5, 7, 11-16
A	WO 92/06096 A1 (大塚製薬株式会社) 1992. 04. 16 (全文参照) & AU 3877593 A & CN 1060844 A & EP 503099 A1 & JP 5-948 A & JP 5-112571 A & US 5420128 A	1-23

(発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC)) の続き)

//(C07D487/14, 207:00, 231:00, 239:00) (C07D491/147, 231:00, 239:00, 307:00)

(C07D495/14, 231:00, 239:00, 333:00)

(調査の対象について)

請求の範囲1は非常に多数の化合物を包含している。しかしながら、PCT第6条の意味において明細書に裏付けられ、また、PCT第5条の意味において開示されているのは、クレームされた化合物のごくわずかな部分に過ぎない。

よって、調査は、明細書に裏付けられ、開示されている部分、すなわち、一般式(I)において、Aが5員若しくは6員の炭素環若しくは複素環であり、A以外の縮合環部分がピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン構造、ピロロ[1, 2-a]ピリミジン構造又はピロロ[2, 3-b]ピリジン構造を有し、R3がフェニル基又はピリジル基であるものについて行った。

請求の範囲2-23についても同様である。